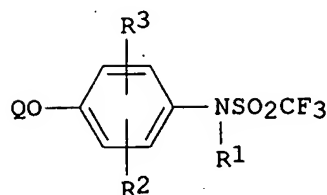


PATENT NO.	KIND	DATE	APPLICATION NO.	DATE
JP 10007657	A2	19980113	JP 1996-158177	19960619
PRIORITY APPLN. INFO.:			JP 1996-158177	19960619
OTHER SOURCE(S):	MARPAT	128:167414		
GI				



I

AB Sulfonamides I (R1 = H, C2-6 alkanoyl, benzoyl; R2, R3 = H, halo, NO2, cyano, (substituted) lower alkyl, (substituted) lower alkoxy, etc.; R2R3 may form Ph or naphthalene; Q = (substituted) pyrazinyl, (substituted) 4-pyrimidinyl, (substituted) oxazolyl, (substituted) thiazolyl, (substituted) quinoxalyl, (substituted) quinazolyl, etc.; if Q = thiazolyl and R2 = R3, then R2 = R3 ≠ H) are prepared 2-(4-Amino-3-methoxycarbonylphenoxy)-4-chloro-5-difluoromethylthiazole was amidated with F3CSO3H in the presence of Et3N in CH2Cl2 under ice-cooling for 30 min, decomposed with NaOH in THF-H2O at room temperature for 1 h to give

86% I (R1

= H, R2 = 2-CO2Me, R3 = H, Q = 4-chloro-5-difluoromethyl-2-thiazolyl) (II). II at 5 g/a preemergence controlled 91-100% Echinochloa oryzicola and broadleaf weeds, 71-90% Scirpus juncooides, and 31-50% Cyperus serotinus growth without damaging rice plants.

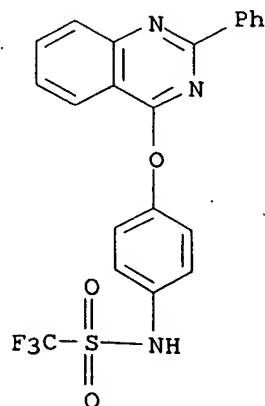
IT 202752-73-6

RL: AGR (Agricultural use); BAC (Biological activity or effector, except adverse); BSU (Biological study, unclassified); BIOL (Biological study); USES (Uses)

(preparation of phenylmethanesulfonamides as herbicides)

RN 202752-73-6 CAPLUS

CN Methanesulfonamide, 1,1,1-trifluoro-N-[4-[(2-phenyl-4-quinazolinyloxy)phenyl]- (9CI) (CA INDEX NAME)



PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 10-007657

(43)Date of publication of application : 13.01.1998

(51)Int.Cl.

C07D231/18
 A01N 47/04
 C07D239/34
 C07D239/80
 C07D241/18
 C07D241/44
 C07D249/12
 C07D251/22
 C07D253/06
 C07D257/04
 C07D263/38
 C07D263/58
 C07D277/34
 C07D277/68
 C07D285/08
 C07D285/10
 C07D285/12

(21)Application number : 08-158177

(71)Applicant : SANKYO CO LTD

(22)Date of filing : 19.06.1996

(72)Inventor : SATO KAZUO

KUDO NORIAKI

HONMA TOYOKUNI

KOI KIYOSHI

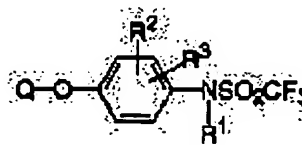
KADOTANI JUNJI

(54) SULFONAMIDE COMPOUND

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new sulfonamide compound that has excellent herbicidal activity without chemical injury to rice and is safe as a herbicide.

SOLUTION: This new sulfonamide compound of formula I (R¹ is H, a 26C alkanoyl or benzoyl; R² and R³ are each H, a halogen, nitro, cyano a lower alkyl, etc.; Q is pyradinyl, 4pyrimidinyl, oxazolyl, thiazolyl, etc., provided that when Q is thiazolyl, R² and R³ are not H at the same time), for example, N-[4-(2-pyradinyoxy)phenyl]



trifluoromethane sulfonamide. The compound of formula I is obtained, for example, by a substitution reaction of a compound of formula: Q-Y (Y is a halogen or an eliminated group, such as methanesulfonyl) with a compound of formula II to form an ether, reduction of the nitro group, and a subsequent reaction with a reactive trifluoromethanesulfonic derivative. Using this sulfonamide compound as an effective ingredient, different herbicide formulations against different weeds in crop fields can be obtained.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

* NOTICES *

JPO and NCIPi are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.

2. **** shows the word which can not be translated.

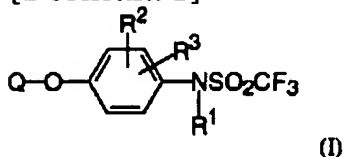
3. In the drawings, any words are not translated.

CLAIMS

[Claim(s)]

[Claim 1] The following general formula (I)

[Formula 1]



R1 shows a hydrogen atom, C2 - C6 alkanoyl radical, or benzoyl among [type. R2 and R3 respectively the same -- or -- differing -- a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, and a low-grade alkyl group (the low-grade alkyl group concerned) Even if the identities or different 1 thru/or three substituents chosen from the following substituent group A permutes, it is a good lower alkoxy group (the lower alkoxy group concerned). The identities or different 1 thru/or three substituents chosen from the following substituent group A may permute. A low-grade alkoxy carbonyl group, an acetyl group, and formula-C(= NOCH3) CH3 [whether the radical expressed is shown and] Or R2 R3 A naphthalene ring is formed with the phenyl group which becomes together and they combine. Q Pyrazinyl ones, 4-pyrimidinyl, oxazolyl, thiazolyl, quinoxalyl, Chinae-cortex ZORIRU, thiadiazolyl, tetra-ZORIRU, benzoxazolyl, benzothiazolyl, thoria ZORIRU, thoriadinyl, pyrazolyl, and isoxazolyl (pyrazinyl one concerned --) 4-pyrimidinyl, oxazolyl, thiazolyl, quinoxalyl, chinae-cortex ZORIRU, Thiadiazolyl, tetra-ZORIRU, benzoxazolyl, benzothiazolyl, thoria ZORIRU, thoriadinyl, pyrazolyl, and an isoxazolyl group it is chosen out of the following substituent group B -- the same or different 1 thru/or three substituents permute -- you may have (however, when Q is a thiazolyl radical, R2 and R3 are not hydrogen atoms at coincidence) -- it is shown.

((A) Substituent group) The sulfonamide compound expressed with halogen atom, low-grade alkyl group, and lower alkoxy group (substituent group B) halogen atom, low-grade alkyl group, and low-grade halo alkyl group, lower alkoxy group, low-grade halo ARUKOKIRU radical, low-grade alkylthio group, and low-grade alkoxy carbonyl low-grade alkyl group, phenyl group, phenylthio radical, nitro group, and cyano group].

[Claim 2] Q 2-pyrazinyl, 6-chloro-2-pyrazinyl, 3, 6-dichloro-2-pyrazinyl, 5-chloro-2-pyrazinyl, 3-methyl-2-pyrazinyl, 3, 6-dimethyl-2-pyrazinyl, 6-methoxy-2-pyrazinyl,

6-ethoxy-2-pyrazinyl, 5, 6-diphenyl-2-pyrazinyl, 3-(2-ethoxy carbonylethyl)-5, 6-diphenyl-2-pyrazinyl, 5, 6-diphenyl-3-chloro-2-pyrazinyl, 6-nitro-2-pyrazinyl, 6-cyano-2-pyrazinyl, 6-methylthio-2-pyrazinyl, 6-phenylthio-2-pyrazinyl, 5, 6-diphenyl-3-phenylthio-2-pyrazinyl, 5, 6-diphenyl-3-methylthio-2-pyrazinyl, 5, 6-diphenyl-3-propyl thio-2-pyrazinyl, 4-pyrimidinyl, 2-chloro-4-pyrimidinyl, 6-chloro-4-pyrimidinyl, 5-chloro-4-pyrimidinyl, 2, 6-dichloro-4-pyrimidinyl, 2-fluoro-4-pyrimidinyl, 5-fluoro-4-pyrimidinyl, 6-fluoro-4-pyrimidinyl, 2, 6-difluoro-4-pyrimidinyl, 2-chloro-6-fluoro-4-pyrimidinyl, 2-methyl-4-pyrimidinyl, 6-methyl-4-pyrimidinyl, 6-ethyl-4-pyrimidinyl, 5-chloro-6-ethyl-4-pyrimidinyl, 2-methoxy-4-pyrimidinyl, 5-methoxy-4-pyrimidinyl, 6-methoxy-4-pyrimidinyl, 2, 6-dimethoxy-4-pyrimidinyl, 2-ethoxy-4-pyrimidinyl, 6-ethoxy-4-pyrimidinyl, 2-propoxy-4-pyrimidinyl, 6-isopropoxy-4-pyrimidinyl, 2-methylthio-4-pyrimidinyl, 6-methylthio-4-pyrimidinyl, 2-ethyl thio-4-pyrimidinyl, 2-propyl thio-4-pyrimidinyl, 2-isopropyl thio-4-pyrimidinyl, 6-chloro-5-phenyl-2-methylthio-4-pyrimidinyl, 2-methoxy carbonylmethyl-4-pyrimidinyl, 2-nitro-4-pyrimidinyl, 6-nitro-4-pyrimidinyl, 2-cyano-4-pyrimidinyl, 6-cyano-4-pyrimidinyl, 2-oxazolyl, 4-chloro-2-oxazolyl, 5-chloro-2-oxazolyl, 4-fluoro-2-oxazolyl, 5-fluoro-2-oxazolyl, 4-methyl-2-oxazolyl, 4-cyano-2-oxazolyl, 4-nitro-2-oxazolyl, 2-thiazolyl, 4-chloro-2-thiazolyl, 5-chloro-2-thiazolyl, 4, 5-dichloro-2-thiazolyl, 4-nitro-2-thiazolyl, 5-chloro-4-difluoromethyl-2-thiazolyl, 4-ethoxycarbonyl-5-methyl-2-thiazolyl, 4-ethoxycarbonyl-5-trifluoromethyl-2-thiazolyl, 4-methoxycarbonyl-5-methyl-2-thiazolyl, 2-quinoxalyl, 3-chloro-2-quinoxalyl, 3-methoxy-2-quinoxalyl, 3-phenylthio-2-quinoxalyl, 2-chinae-cortex ZORIRU, 4-chinae-cortex ZORIRU, 2-phenyl-4-chinae-cortex ZORIRU, 4-chloro - 1, 2, 5-thiadiazole-3-IRU, 3-phenyl - 1, 2, 4-thiadiazole-5-IRU, 3-trifluoromethyl - 1, 2, 4-thiadiazole-5-IRU, 3-fluoro methyl - 1, 2, 4-thiadiazole-5-IRU, 3-chloro methyl - 1, 2, 4-thiadiazole-5-IRU, 1-methyl tetrazole-5-IRU, 2-benzoxazolyl, 5-fluoro-2-benzoxazolyl, 2-benzothiazolyl, 5-chloro-2-benzothiazolyl, 4-methyl-5-chloro-3-thoria ZORIRU, 4, 5-dimethyl-3-thoria ZORIRU, 4-methyl-5-phenyl-3-thoria ZORIRU, 4-methyl-5-trifluoromethyl-3-thoria ZORIRU, 4-methyl-5-difluoromethyl-3-thoria ZORIRU, 4-methyl-5-(pentafluoro ethyl)-3-thoria ZORIRU, 4-methyl-5-(heptafluoro propyl)-3-thoria ZORIRU, 1,3,5-triazine-2-IRU, 4, 6-dichloro-1,3,5-triazine-2-IRU, 4, 6-dimethyl-1,3,5-triazine-2-IRU, 1 and 2, 4-triazine-3-IRU, 1, 2, 4-triazine-5-IRU, 1 and 2, 4-triazine-6-IRU, 1, 3-dimethyl-5-pyrazolyl, 1-methyl-5-pyrazolyl, 1-methyl-3-chloro-5-pyrazolyl, 1-ethyl -3, 5-dimethyl-4-pyrazolyl, 1, 3-dimethyl-4-chloro-5-pyrazolyl, 1-methyl-3-trifluoromethyl-4-cyano-5-pyrazolyl, 1-methyl-3-trifluoromethyl-5-pyrazolyl, 1-methyl-3-trifluoromethyl-4-chloro-5-pyrazolyl, The sulfonamide compound according to claim 1 which is 1-methyl-5-trifluoromethyl-3-pyrazolyl, 5-methyl-3-isoxazolyl, 4-chloro-5-methyl-3-isoxazolyl, or 3-methyl-5-isoxazolyl.

[Claim 3] The sulfonamide compound according to claim 1 whose Q is thoria ZORIRU, pyrazinyl one, thiazolyl, or 4-pyrimidinyl.

[Claim 4] The sulfonamide compound according to claim 1 whose Q is pyrazinyl.

[Claim 5] The sulfonamide compound according to claim 1 whose Q is 4-pyrimidinyl.

[Claim 6] R1 Compound according to claim 1 to 5 which is a hydrogen atom, a propionyl radical, or a BUCHIROIRU radical.

[Claim 7] R2 And R3 the same -- or -- differing -- hydrogen atom, halogen atom,

low-grade alkyl group, and low-grade alkoxy carbonyl group, acetyl group, or formula-C(= NOCH₃) CH₃ Compound according to claim 1 to 6 which is the radical expressed.

[Claim 8] R₂ And R₃ the same -- or -- differing -- hydrogen atom, halogen atom, methyl group, methoxycarbonyl group, or formula-C(= NOCH₃) CH₃ Compound according to claim 1 to 7 which is the radical expressed.

[Claim 9] The compound according to claim 1 to 8 whose substituent group A is a halogen atom.

[Claim 10] The compound according to claim 1 to 9 whose substituent groups B are a halogen atom, low-grade alkyl group, and low-grade halo alkyl group and a lower alkoxy group.

[Claim 11] The compound according to claim 1 to 10 whose substituent group B is a halogen atom or a low-grade alkyl group.

[Translation done.]

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-7657

(43) 公開日 平成10年(1998) 1月13日

(51) IntCl ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 231/18			C 0 7 D 231/18	
A 0 1 N 47/04			A 0 1 N 47/04	
C 0 7 D 239/34			C 0 7 D 239/34	
239/80			239/80	
241/18			241/18	

審査請求 未請求 請求項の数11 OL (全 26 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平8-158177

(22) 出願日 平成8年(1996) 6月19日

(71) 出願人 000001856

三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号

(72) 発明者 佐藤 一雄

滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会
社内

(72) 発明者 工藤 法明

滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会
社内

(72) 発明者 本間 豊邦

滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会
社内

(74) 代理人 弁理士 大野 彰夫 (外2名)

最終頁に続く

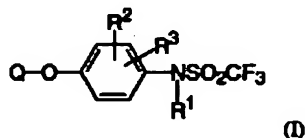
(54) 【発明の名称】 スルホンアミド化合物

(57) 【要約】

【課題】イネに薬害のない優れた除草活性を有する新規なスルホンアニリド誘導体を見出すこと。

【解決手段】下記一般式 (I)

【化1】



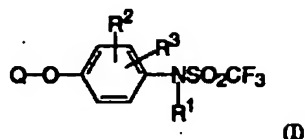
[R¹ = H等、R²、R³ = H、ハロゲン原子、低級アルキル基等、Q = ピラジニル、4-ピリミジニル等] で表わされるスルホンアミド化合物。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】下記一般式(I)

【化1】



【式中、R¹ は、水素原子、C2～C6アルカノイル基又はベンゾイル基を示し、R² 及びR³ は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、低級アルキル基（当該低級アルキル基は、下記置換基群Aから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい）、低級アルコキシ基（当該低級アルコキシ基は、下記置換基群Aから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい）、低級アルコキシカルボニル基、アセチル基、式-C(=NOCH₃)CH₃で表わされる基を示すか、若しくはR² とR³ が一緒になってそれらが結合するフェニル基とともにナフタレン環を形成し、Qは、

ビラジニル、4-ピリミジニル、オキサゾリル、チアゾリル、キノキサリル、キナゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、

トリアゾリル、トリアジニル、ヒラゾリル、イソキサゾリル（当該ビラジニル、4-ピリミジニル、オキサゾリル、チアゾリル、キノキサリル、キナゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、トリアゾリル、トリアジニル、ヒラゾリル、イソキサゾリル基は、下記置換基群Bから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい）（但し、Qがチアゾリル基である場合には、R² 及びR³ は同時に水素原子ではない）を示す。

（置換基群A）ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基
（置換基群B）ハロゲン原子、低級アルキル基、低級ハロアルキル基、低級アルコキシ基、低級ハロアルコキシル基、低級アルキルチオ基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、フェニル基、フェニルチオ基、ニトロ基、シアノ基で表わされるスルホンアミド化合物。
【請求項2】Qが、2-ビラジニル、6-クロロ-2-ビラジニル、3, 6-ジクロロ-2-ビラジニル、5-クロロ-2-ビラジニル、3-メチル-2-ビラジニル、3, 6-ジメチル-2-ビラジニル、6-メトキシ-2-ビラジニル、6-エトキシ-2-ビラジニル、5, 6-ジフェニル-2-ビラジニル、3-(2-エトキシカルボニルエチル)-5, 6-ジフェニル-2-ビラジニル、5, 6-ジフェニル-3-クロロ-2-ビラジニル、6-ニトロ-2-ビラジニル、6-シアノ-2-ビラジニル、6-メチルチオ-2-ビラジニル、6-フェニルチオ-2-ビラジニル、5, 6-ジフェニル-

2

3-フェニルチオ-2-ビラジニル、5, 6-ジフェニル-3-メチルチオ-2-ビラジニル、5, 6-ジフェニル-3-プロピルチオ-2-ビラジニル、4-ピリミジニル、2-クロロ-4-ピリミジニル、6-クロロ-4-ピリミジニル、5-クロロ-4-ピリミジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリミジニル、2-フルオロ-4-ピリミジニル、5-フルオロ-4-ピリミジニル、6-フルオロ-4-ピリミジニル、2, 6-ジフルオロ-4-ピリミジニル、2-クロロ-6-フルオロ-4-ピリミジニル、2-メチル-4-ピリミジニル、6-メチル-4-ピリミジニル、6-エチル-4-ピリミジニル、5-クロロ-6-エチル-4-ピリミジニル、2-メトキシ-4-ピリミジニル、5-メトキシ-4-ピリミジニル、6-メトキシ-4-ピリミジニル、2, 6-ジメトキシ-4-ピリミジニル、2-エトキシ-4-ピリミジニル、6-エトキシ-4-ピリミジニル、2-プロポキシ-4-ピリミジニル、6-イソプロポキシ-4-ピリミジニル、2-メチルチオ-4-ピリミジニル、6-メチルチオ-4-ピリミジニル、2-エチルチオ-4-ピリミジニル、2-プロピルチオ-4-ピリミジニル、2-イソプロピルチオ-4-ピリミジニル、6-クロロ-5-フェニル-2-メチルチオ-4-ピリミジニル、2-メトキシカルボニルメチル-4-ピリミジニル、2-ニトロ-4-ピリミジニル、6-ニトロ-4-ピリミジニル、2-シアノ-4-ピリミジニル、6-シアノ-4-ピリミジニル、2-オキサゾリル、4-クロロ-2-オキサゾリル、5-クロロ-2-オキサゾリル、4-フルオロ-2-オキサゾリル、5-フルオロ-2-オキサゾリル、4-メチル-2-オキサゾリル、4-シアノ-2-オキサゾリル、4-ニトロ-2-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-クロロ-2-チアゾリル、5-クロロ-2-チアゾリル、4, 5-ジクロロ-2-チアゾリル、4-ニトロ-2-チアゾリル、5-クロロ-4-ジフルオロメチル-2-チアゾリル、4-エトキシカルボニル-5-メチル-2-チアゾリル、4-エトキシカルボニル-5-トリフルオロメチル-2-チアゾリル、4-メトキシカルボニル-5-メチル-2-チアゾリル、2-キノキサリル、3-クロロ-2-キノキサリル、3-メトキシ-2-キノキサリル、3-フェニルチオ-2-キノキサリル、2-キナゾリル、4-キナゾリル、2-フェニル-4-キナゾリル、4-クロロ-1, 2, 5-チアジアゾール-3-イル、3-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-トリフルオロメチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-フルオロメチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-クロロメチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1-メチルテトラゾール-5-イル、2-ベンゾキサゾリル、5-フルオロ-2-ベンゾキサゾリル、2-ベンゾチアゾリル、5-クロロ-2-ベンゾチアゾリル、4-メチル-5-クロロ-3-トリ

アゾリル、4, 5-ジメチル-3-トリアゾリル、4-メチル-5-フェニル-3-トリアゾリル、4-メチル-5-トリフルオロメチル-3-トリアゾリル、4-メチル-5-ジフルオロメチル-3-トリアゾリル、4-メチル-5-(ペンタフルオロエチル)-3-トリアゾリル、4-メチル-5-(ヘプタフルオロプロピル)-3-トリアゾリル、1, 3, 5-トリアジン-2-イル、4, 6-ジクロロ-1, 3, 5-トリアジン-2-イル、4, 6-ジメチル-1, 3, 5-トリアジン-2-イル、1, 2, 4-トリアジン-3-イル、1, 2, 4-トリアジン-5-イル、1, 2, 4-トリアジン-6-イル、1, 3-ジメチル-5-ピラゾリル、1-メチル-5-ピラゾリル、1-メチル-3-クロロ-5-ピラゾリル、1-エチル-3, 5-ジメチル-4-ピラゾリル、1, 3-ジメチル-4-クロロ-5-ピラゾリル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-シアノ-5-ピラゾリル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-クロロ-5-ピラゾリル、1-メチル-5-トリフルオロメチル-3-ピラゾリル、5-メチル-3-イソキサゾリル、4-クロロ-5-メチル-3-イソキサゾリル又は3-メチル-5-イソキサゾリルである、請求項1に記載のスルホンアミド化合物。

【請求項3】Qが、トリアゾリル、ピラジニル、チアゾリル又は4-ピリミジニルである、請求項1に記載のスルホンアミド化合物。

【請求項4】Qが、ピラジニルである、請求項1に記載のスルホンアミド化合物。

【請求項5】Qが、4-ピリミジニルである、請求項1に記載のスルホンアミド化合物。

【請求項6】R¹ が水素原子、プロピオニル基又はブチロイル基である、請求項1乃至5に記載の化合物。

【請求項7】R² 及びR³ が、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、アセチル基又は式-C(=NOCH₃)CH₃で表わされる基である、請求項1乃至6に記載の化合物。

【請求項8】R² 及びR³ が、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、メチル基、メトキシカルボニル基又は式-C(=NOCH₃)CH₃で表わされる基である、請求項1乃至7に記載の化合物。

【請求項9】置換基群Aが、ハロゲン原子である、請求項1乃至8に記載の化合物。

【請求項10】置換基群Bが、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級ハロアルキル基、低級アルコキシ基である、請求項1乃至9に記載の化合物。

【請求項11】置換基群Bが、ハロゲン原子又は低級アルキル基である、請求項1乃至10に記載の化合物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、強力な除草作用を示す新規スルホンアミド化合物及び該化合物を有効成分とする除草剤に関する。

【0002】

【従来の技術】これまで、ある種のスルホンアニリド誘導体が除草活性を有することは、例えば、特許公開平2-149567号公報(但し、スルホンアミド基と、ベンゼン環の置換分としてのピリミジニルオキシ又はトリアジニルオキシ基とはオルト位置換に限定した化合物のみである)、米国特許3, 679, 695号公報(但し、本願一般式(I)のQに対応する置換基は2-チアゾリル基であり、R² 及びR³ は水素原子を示す化合物のみである)及び米国特許4, 345, 076号公報(但し、本願一般式(I)のQに対応する置換基はピリダジニル基である化合物である)に記載されている。又、特許公開昭60-222461号公報にもある種のスルホンアニリド誘導体が記載されており、防虫活性があることは示されているが、それらが除草活性を有することは何ら記載されていない。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】前記特許公開平2-149567号公報に記載の化合物は、後記試験例で示すように、除草活性が低薬量施用時において十分ではない。

【0004】前記米国特許3, 679, 695号公報に記載の化合物も、後記試験例で示すように、イネに対する薬害が強く、除草剤として安全に使用できるものではない。

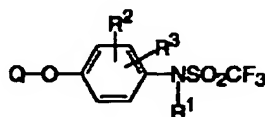
【0005】本発明者等は、スルホンアニリド構造を有する誘導体の合成とその薬理活性について永年に亘り鋭意研究を行なった結果、既知の化合物とは全く構造を異にする新規なスルホンアニリド誘導体が、イネに薬害のない優れた除草活性を有することを見出し、本発明を完成した。

【0006】

【課題を解決するための手段】本発明は、下記一般式(I)

【0007】

【化2】



(I)

【0008】〔式中、R¹ は、水素原子、C2~C6アルカノイル基又はベンゾイル基を示し、R² 及びR³ は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、低級アルキル基(当該低級アルキル基は、下記置換基群Aから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい)、低

5

級アルコキシ基（当該低級アルコキシ基は、下記置換基群Aから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい）、低級アルコキシカルボニル基、アセチル基、式 $-C(=NOCH_3)CH_3$ で表わされる基を示すか、若しくは R^2 と R^3 が一緒になってそれらが結合するフェニル基とともにナフタレン環を形成し、Qは、ピラジニル、4-ピリミジニル、オキサゾリル、チアゾリル、キノキサリル、キナゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、トリアゾリル、トリアジニル、ピラゾリル、イソキサゾリル（当該ピラジニル、4-ピリミジニル、オキサゾリル、チアゾリル、キノキサリル、キナゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、トリアゾリル、トリアジニル、ピラゾリル、イソキサゾリル基は、下記置換基群Bから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい）（但し、Qがチアゾリル基である場合には、 R^2 及び R^3 は同時に水素原子ではない）を示す。

【0009】（置換基群A）ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基

（置換基群B）ハロゲン原子、低級アルキル基、低級ハロアルキル基、低級アルコキシ基、低級ハロアルコキル基、低級アルキルチオ基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、フェニル基、フェニルチオ基、ニトロ基、シアノ基で表わされるスルホンアミド化合物である。

【0010】本願において、「 $C_2 \sim C_6$ アルカノイル基」とは、例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、シクロプロパンカルボニル、シクロブタンカルボニルのような総炭素数1乃至5個の直鎖、分岐鎖又は環状アルキル基にカルボニル基が結合した基であり、好適にはプロピオニル、ブチリル、シクロプロパンカルボニル、シクロブタンカルボニルであり、更に好適には、プロピオニル基である。本願において、「ハロゲン原子」とは、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子であり、好適には弗素原子又は塩素原子であり、更に好適には塩素原子である。

【0011】本願において、「低級アルキル基」とは、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピルのような炭素数1乃至3個の直鎖又は分岐鎖アルキル基であり、好適にはメチル基である。

【0012】本願において、「置換基群Aから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい低級アルキル基」とは、前記「低級アルキル基」及び、例えば、クロロメチル、ブロモメチル、トリフルオロメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、エトキシエチル、メトキシプロピルのような炭素数1乃至3個の直鎖又は分岐鎖アルキル基が置換基群Aから選ばれる

6

同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換された基であり、好適には、メチル基である。

【0013】本願において、「低級アルコキシ基」とは、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシのような炭素数1乃至3個の直鎖又は分岐鎖アルコキシ基であり、好適にはメトキシ基である。

【0014】本願において、「置換基群Aから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい低級アルコキシ基」とは、前記「低級アルコキシ基」及び、例えば、クロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、メトキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、2-メトキシプロポキシのような炭素数1乃至3個の直鎖又は分岐鎖アルコキシ基が置換基群Aから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換された基であり、好適には、メトキシ基である。

【0015】本願において、「低級アルコキシカルボニル基」とは、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニルのような、前記「低級アルコキシ基」がカルボニル基に結合した基であり、好適には、メトキシカルボニル基である。

【0016】本願において、「低級ハロアルキル基」とは、例えば、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基のように、ハロゲン原子が1乃至7個前記「低級アルキル基」に置換した基であり、好適には、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基である。

【0017】本願において、「低級ハロアルコキル基」とは、前記「低級ハロアルキル基」に酸素原子が結合した基であり、好適には2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基である。

【0018】本願において、「低級アルキルチオ基」とは、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオのような前記「低級アルキル基」に硫黄原子が結合した基であり、好適には、メチルチオ基である。

【0019】本願において、「低級アルコキルカルボニル低級アルキル基」とは、例えば、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、メトキシカルボニルエチル、エトキシカルボニルエチル、2-メトキシカルボニルプロピル、イソプロポキシカルボニルメチルのような、総炭素数3乃至5個の直鎖又は分岐鎖アルコキシカルボニルアルキル基であり、好適には、エトキシカルボニルエチル基である。

【0020】本願において、Qの例としては、2-ピラ

ジニル、6-クロロ-2-ピラジニル、3, 6-ジクロロ-2-ピラジニル、5-クロロ-2-ピラジニル、3-メチル-2-ピラジニル、3, 6-ジメチル-2-ピラジニル、6-メトキシ-2-ピラジニル、6-エトキシ-2-ピラジニル、5, 6-ジフェニル-2-ピラジニル、3-(2-エトキシカルボニルエチル)-5, 6-ジフェニル-2-ピラジニル、5, 6-ジフェニル-3-クロロ-2-ピラジニル、6-ニトロ-2-ピラジニル、6-シアノ-2-ピラジニル、6-メチルチオ-2-ピラジニル、6-フェニルチオ-2-ピラジニル、5, 6-ジフェニル-3-フェニルチオ-2-ピラジニル、5, 6-ジフェニル-3-メチルチオ-2-ピラジニル、5, 6-ジフェニル-3-プロピルチオ-2-ピラジニル、4-ピリミジニル、2-クロロ-4-ピリミジニル、6-クロロ-4-ピリミジニル、5-クロロ-4-ピリミジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリミジニル、2-フルオロ-4-ピリミジニル、5-フルオロ-4-ピリミジニル、6-フルオロ-4-ピリミジニル、2, 6-ジフルオロ-4-ピリミジニル、2-クロロ-6-フルオロ-4-ピリミジニル、2-メチル-4-ピリミジニル、6-メチル-4-ピリミジニル、6-エチル-4-ピリミジニル、5-クロロ-6-エチル-4-ピリミジニル、2-メトキシ-4-ピリミジニル、5-メトキシ-4-ピリミジニル、6-メトキシ-4-ピリミジニル、2, 6-ジメトキシ-4-ピリミジニル、2-エトキシ-4-ピリミジニル、6-エトキシ-4-ピリミジニル、2-プロポキシ-4-ピリミジニル、6-イソプロポキシ-4-ピリミジニル、2-メチルチオ-4-ピリミジニル、6-メチルチオ-4-ピリミジニル、2-エチルチオ-4-ピリミジニル、2-プロピルチオ-4-ピリミジニル、2-イソプロピルチオ-4-ピリミジニル、6-クロロ-5-フェニル-2-メチルチオ-4-ピリミジニル、2-メトキシカルボニルメチル-4-ピリミジニル、2-ニトロ-4-ピリミジニル、6-ニトロ-4-ピリミジニル、2-シアノ-4-ピリミジニル、6-シアノ-4-ピリミジニル、2-オキサゾリル、4-クロロ-2-オキサゾリル、5-クロロ-2-オキサゾリル、4-フルオロ-2-オキサゾリル、5-フルオロ-2-オキサゾリル、4-メチル-2-オキサゾリル、4-シアノ-2-オキサゾリル、4-ニトロ-2-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-クロロ-2-チアゾリル、5-クロロ-2-チアゾリル、4, 5-ジクロロ-2-チアゾリル、4-ニトロ-2-チアゾリル、5-クロロ-4-ジフルオロメチル-2-チアゾリル、4-エトキシカルボニル-5-メチル-2-チアゾリル、4-エトキシカルボニル-5-トリフルオロメチル-2-チアゾリル、4-メトキシカルボニル-5-メチル-2-チアゾリル、2-キノキサリル、3-クロロ-2-キノキサリル、3-メトキシ-2-キノキサリル、3-フェニルチオ-2-キノキサリル、2-

キナゾリル、4-キナゾリル、2-フェニル-4-キナゾリル、4-クロロ-1, 2, 5-チアジアゾール-3-イル、3-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-トリフルオロメチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-フルオロメチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-クロロメチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1-メチルテトラゾール-5-イル、2-ベンゾキサゾリル、5-フルオロ-2-ベンゾキサゾリル、2-ベンゾチアゾリル、5-クロロ-2-ベンゾチアゾリル、4-メチル-5-クロロ-3-トリアゾリル、4, 5-ジメチル-3-トリアゾリル、4-メチル-5-フェニル-3-トリアゾリル、4-メチル-5-トリフルオロメチル-3-トリアゾリル、4-メチル-5-ジフルオロメチル-3-トリアゾリル、4-メチル-5-(ペンタフルオロエチル)-3-トリアゾリル、4-メチル-5-(ヘプタフルオロプロピル)-3-トリアゾリル、1, 3, 5-トリアジン-2-イル、4, 6-ジクロロ-1, 3, 5-トリアジン-2-イル、4, 6-ジメチル-1, 3, 5-トリアジン-2-イル、1, 2, 4-トリアジン-3-イル、1, 2, 4-トリアジン-5-イル、1, 2, 4-トリアジン-6-イル、1, 3-ジメチル-5-ピラゾリル、1-メチル-5-ピラゾリル、1-メチル-3-クロロ-5-ピラゾリル、1-エチル-3, 5-ジメチル-4-ピラゾリル、1, 3-ジメチル-4-クロロ-5-ピラゾリル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-シアノ-5-ピラゾリル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-クロロ-5-ピラゾリル、1-メチル-5-トリフルオロメチル-3-ピラゾリル、5-メチル-3-イソキサゾリル、4-クロロ-5-メチル-3-イソキサゾリル、3-メチル-5-イソキサゾリル等をあげることができ、好適には、トリアゾリル、ピラジニル、チアゾリル又は4-ピリミジニルであり、更に好適には、ピラジニル又は4-ピリミジニルである。

【0021】本願一般式(I)の化合物において、R¹は、好適には、水素原子、プロピオニル基又はブチロイル基であり、R²及びR³は、好適には、水素原子、ハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基、アセチル基又は式-C(=NOCH₃)CH₃で表わされる基であり、更に好適には、水素原子、ハロゲン原子、メトキシカルボニル基又は式-C(=NOCH₃)CH₃で表わされる基である。

【0022】Qは、好適には、トリアゾリル、ピラジニル、チアゾリル又は4-ピリミジニルであり、更に好適には、ピラジニル又は4-ピリミジニルである。

【0023】置換基群Aは、好適には、ハロゲン原子である。

【0024】置換基群Bは、好適には、ハロゲン原子、

低級アルキル基、低級ハロアルキル基又は低級アルコキシ基であり、更に好適には、ハロゲン原子又は低級アルキル基である。

【0025】一般式(Ⅰ)の化合物としては、好適には、 R^1 が、水素原子又はC2～C5アルカノイル基であり、 R^2 及び R^3 が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、メチル基、メトキシカルボニル基、アセチル基又は式 $-C(=NOCH_3)CH_3$ で表わされる基であり、Qが、トリアゾリル、ピラジニル、チアゾリル又は4-ピリミジニルであり、このQは、下記置換基群Bから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されてもよい。

【0026】(置換基群B)ハロゲン原子、低級アルキル基、低級ハロアルキル基、低級アルコキシ基以下、表1に、本発明の化合物を化合物番号とともに例示するが、本発明はこれらの化合物に限定されるものではない。

【0027】なお、表中、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Ph」はフェニル基を、

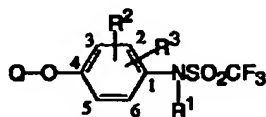
*ル基を、「Pyz」はピラジニル基を、「Pym」はピリミジニル基を、「Oxa」はオキサゾリル基を、「Thiz」はチアゾリル基を、「Qun」はキノキサリニル基を、「Quz」はキナゾリル基を、「Thid」はチアジアゾリル基を、「Tetz」はテトラゾリル基を、「Boxa」はベンゾキサゾリル基を、「Bthi」はベンゾチアゾリル基を、「Tria」はトリアゾリル基を、「Triz」はトリアジニル基を、「Pyra」はピラゾリル基を、「Isoz」はイソキサゾリル基を、それぞれ示す。

【0028】

【表1】

【0029】

【化3】



(Ⅰ)

【0030】

化合物番号	R^1	R^2, R^3	Q	融点(℃)
1	H	H	2-Pyz	114
2	H	H	3-Cl-2-Pyz	114
3	H	H	6-Cl-2-Pyz	88-91
4	H	H	3,6-Me ₂ -2-Pyz	135-138
5	H	H	5,6-Ph ₂ -2-Pyz	153-155
6	H	H	3-Cl-5,6-Ph ₂ -2-Pyz	114
7	H	H	5,6-Ph ₂ -3-(2-CH ₂ CH ₂ COOEt)-2-Pyz	114
8	H	2,3-Cl ₂	2-Pyz	
9	H	2-Cl	2-Pyz	
10	H	3-Cl	2-Pyz	
11	H	2-F	2-Pyz	
12	H	3-F	2-Pyz	
13	H	H	2-Pyz	
14	H	H	3-MeO-2-Qun	171-175
15	H	H	3-Cl-2-Qun	198-202
16	H	3-Me	6-Cl-2-Pyz	106-109
17	H	2,3-Me ₂	6-Cl-2-Pyz	154-156
18	H	2,5-Me ₂	6-Cl-2-Pyz	118-120
19	H	2,3-C ₄ H ₉ -	6-Cl-2-Pyz	159-164
20	H	3,5-Cl ₂	6-Cl-2-Pyz	172-177
21	H	2,6-Br ₂	6-Cl-2-Pyz	114
22	H	2-Cl	6-Cl-2-Pyz	
23	H	2-COOMe	6-Cl-2-Pyz	79.5
24	H	2-C(=NOMe)Me	6-Cl-2-Pyz	114
25	COEt	2-C(=NOMe)Me	6-Cl-2-Pyz	114
26	H	2-COOMe	6-F-2-Pyz	
27	COEt	2-COOMe	6-Cl-2-Pyz	114

11				
28	H	2-COOMe	5,6-Ph ₂ -3-SPh-2-Pyz	270
29	H	2-COOMe	5,6-Ph ₂ -3-SMe-2-Pyz	747-777
30	H	2-COOMe	5,6-Ph ₂ -3-SnPr-2-Pyz	255-260
31	COEt	2-Cl	6-F-2-Pyz	
32	COEt	2-F	6-Cl-2-Pyz	
33	COEt	2,3-Cl ₂	6-Me-2-Pyz	
34	COEt	2,3-F ₂	6-CF ₃ -2-Pyz	
35	CO _n Pr	2-Cl	6-Cl-2-Pyz	
36	CO _n Pr	2-COOMe	6-Cl-2-Pyz	
37	H	H	6-OMe-4-Pym	115-117
38	H	H	2-OEt-4-Pym	150-153
39	H	H	2-SMe-4-Pym	187-190
40	H	H	2-SEt-4-Pym	
41	H	H	6-OEt-4-Pym	121-124
42	H	H	2-Cl-6-F-4-Pym	135-137
43	H	H	6-OiPr-4-Pym	141-143
44	H	2,3-Cl ₂	6-OCH ₂ CF ₃ -4-Pym	135-136
45	COEt	2,6-Cl ₂	4-Pym	
46	COEt	3-OMe	2-OMe-4-Pym	
47	COMe	3-NO ₂	2-OMe-4-Pym	
48	CO _n Pr	3-CN	2-Cl-4-Pym	
49	COiPr	2-Et	2-Cl-4-Pym	
50	CO _n Bu	2-nPr	6-Cl-4-Pym	
51	COiBu	2-iPr	6-F-4-Pym	
52	COsBu	2-Cl	2-Cl-6-Me-4-Pym	
53	CO _n C ₅ H ₁₁ O	2-COOMe	2-F-4-Pym	
54	COCH ₂ CH ₂ iPr	2-F	2-Cl-4-Pym	
55	COCH ₂ sBu	2-F	2-OMe-4-Pym	
56	COPh	2-C(=NOMe)Me	2-OMe-4-Pym	
57	H	H	4-Pym	177-179
58	H	H	2-Cl-4-Pym	95-97
59	H	H	6-Cl-4-Pym	139-143
60	H	H	2,6-Cl ₂ -4-Pym	
61	H	H	2,6-(MeO) ₂ -4-Pym	154-155
62	H	H	2-Cl-6-Me-4-Pym	141-143
63	H	H	6-Cl-2-MeS-4-Pym	143
64	H	H	5-Cl-6-Et-4-Pym	169-171
65	H	H	2-MeO-4-Pym	118-120
66	H	H	2-Ph-4-Quz	170
67	H	H	1,3,5-Triz	
68	H	H	4,6-(MeO) ₂ -1,3,5-Tri -2-yl	747
69	H	H	4,6-Cl ₂ -1,3,5-Triz -2-yl	747
70	H	H	1,2,4-Triz-3-yl	
71	H	H	1,2,4-Triz-5-yl	
72	H	H	1,2,4-Triz-6-yl	
73	H	H	4,5-Ph ₂ -2-Oxa	178-180
74	H	H	2-Oxa	
75	COEt	2-C(=NOMe)Me	2-Thiz	

13				
76	H	2-Cl	2-Thiz	
77	H	H	Boxa	160-165
78	H	H	BThiz	147
79	H	2-Cl	BThiz	
80	H	H	1-Me-Tetz-5-yl	139-141
81	H	H	4-Cl-1,2,5-Thid-3-yl	141
82	H	2-Cl	4-F-1,2,5-Thid-3-yl	
83	COEt	2-COOMe	4-Cl-1,2,5-Thid-3-yl	
84	H	2-C(=NOMe)Me	4-CF ₃ -1,2,5-Thid-3-yl	
85	COPh	2-COOMe	4-Me-1,2,5-Thid-2-yl	
86	H	H	3-Me-1,2,4-Thid-5-yl	
87	H	H	3-Ph-1,2,4-Thid-5-yl	143-144
88	H	2-COOMe	3-Cl-1,2,4-Thid-5-yl	
89	H	2-Cl	3-CHF ₂ -1,2,4-Thid-5-yl	
90	H	2-COOMe	3-SPh-2-Qun	141
91	COMe	2-Cl	2-Qun	
92	COEt	2-COOMe	3-CF ₃ -2-Qun	
93	CO _n Pr	2-F	3-CHF ₂ -2-Qun	
94	COPh	2-C(=NOMe)Me	3-CN-2-Qun	
95	H	H	5-CF ₃ -1,3,4-Thid-2-yl	
96	COEt	2-COOMe	5-CF ₃ -1,3,4-Thid-2-yl	
97	COEt	2-C(=NOMe)Me	5-CF ₃ -1,3,4-Thid-2-yl	
98	CO _n Pr	2-Cl	5-CHF ₂ -1,3,4-Thid-2-yl	
99	COPh	2-F	5-F-1,3,4-Thid-2-yl	
100	H	2-COOMe	5-Cl-1,3,4-Thid-2-yl	
102	CO _n Pr	2-Cl	5-Ph-1,3,4-Thid-2-yl	
103	H	2-COOMe	2-Thiz	141
104	H	2-C(=NOMe)Me	2-Thiz	141
105	H	3-COOMe	2-Thiz	141
106	COEt	2-COOMe	4,5-Cl ₂ -2-Thiz	
107	H	H	5-NO ₂ -2-Thiz	141
108	COEt	H	5-NO ₂ -2-Thiz	129-131
109	H	H	4-Cl-5-CHF ₂ -2-Thiz	115
110	COEt	H	4-Cl-5-CHF ₂ -2-Thiz	83.5
111	H	2-COOMe	4-Cl-5-CHF ₂ -2-Thiz	141
112	H	2-Cl	4-Cl-5-CHF ₂ -2-Thiz	
113	H	2-C(=NOMe)Me	4-Cl-5-CHF ₂ -2-Thiz	141
114	COEt	2-COOMe	4-Cl-5-CHF ₂ -2-Thiz	141
115	COEt	2-Cl	Boxa	
116	COPh	2-COOMe	Boxa	
117	COEt	2-COOMe	Bthiz	
118	COPh	2-C(=NOMe)Me	Bthiz	
119	H	H	5-COOEt-4-Me-2-Thiz	125-126
120	COEt	H	5-COOEt-4-Me-2-Thiz	100
121	H	H	5-COOEt-4-CF ₃ -2-Thiz	141
122	COEt	H	5-COOEt-4-CF ₃ -2-Thiz	141
123	COEt	H	5-COOMe-4-Me-2-Thiz	141
124	H	H	5-COOMe-4-Me-2-Thiz	119-122
125	H	3-COOMe	4,6-(OMe) ₂ -1,3,5-Triz-2-yl	114-117

15					
126	H	2-COOMe	4,6-(OMe) ₂ -1,3,5- Triz-2-yl	114	
127	COEt	H	4,6-Cl ₂ -1,3,5- Triz-2-yl		
128	COMe	H	1,2,4-Triz-3-yl		
129	COEt	H	1,2,4-Triz-5-yl		
130	OPh	H	1,2,4-Triz-6-yl		
131	H	H	2,5-Me ₂ -Pyr-3-yl	170-172	
132	H	H	1-Me-Pyr-5-yl		
133	H	H	2-Me-5-CF ₃ -4-CN -Pyr-3-yl	114	
134	H	H	2,5-Me ₂ -4-Cl -Pyr-3-yl	185-186	
135	H	2-Cl	1-Me-Pyr-5-yl		
136	COEt	2-COOMe	1,3-Me ₂ -Pyr-5-yl		
137	ONPr	2-C(=NOMe)Me	1,3-Me ₂ -4-Cl -Pyr-5-yl		
138	OPh	H	1,3-Me ₂ -4-Cl -Pyr-5-yl		
139	H	H	1-Et-3,5-Me ₂ -4-Pyrazyl	114	
140	H	H	5-Ph-4-Me- 1,2,4-Triz-3-yl	220-221	
141	COEt	H	5-Ph-4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	53-56	
142	H	2-COOMe	5-Ph-4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	114	
143	COEt	2-COOMe	5-Ph-4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	114	
144	H	H	5-Ph-2-Me-1,2,4- Triz-3-yl	148-150	
145	COEt	H	5-Ph-2-Me-1,2,4- Triz-3-yl	114	
146	H	H	5-CF ₃ -4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	188-189	
147	COEt	H	5-CF ₃ -4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	68	
148	H	2-COOMe	5-CF ₃ -4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	91-93	
149	COEt	2-COOMe	5-CF ₃ -4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	114	
150	H	2-COMe	5-CF ₃ -4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	114	
151	H	2-C(=NOMe)Me	5-CF ₃ -4-Me-1,2,4- Triz-3-yl	118-122	
152	COEt	2-C(=NOMe)Me	5-CF ₃ -4-Me-1,2,4- Tria-3-yl	114	
153	H	H	5-CHF ₂ -4-Me-1,2,4- Tria-3-yl	209-210	
154	COEt	H	5-CHF ₂ -4-Me-1,2,4-	104-105	

17			18
			Tria-3-yl
155	H	H	5-CF ₂ CF ₃ -4-Me-1,2,4- 191-193
			Tria-3-yl
156	H	H	5-CF ₂ CF ₂ CF ₃ -4-Me 162
			-1,2,4-Tria-3-yl
157	COEt	H	5-CF ₂ CF ₂ CF ₃ -4-Me 126-129
			-1,2,4-Tria-3-yl
158	H	2-COOMe	5-CF ₂ CF ₂ CF ₃ -4-Me 71-73
			-1,2,4-Tria-3-yl
159	COEt	2-COOMe	5-CF ₂ CF ₂ CF ₃ -4-Me 114
			-1,2,4-Tria-3-yl
160	H	2-COMe	5-CF ₂ CF ₂ CF ₃ -4-Me 114
			-1,2,4-Tria-3-yl
161	H	2-C(=NOMe)Me	5-CF ₂ CF ₂ CF ₃ -4-Me 41
			-1,2,4-Tria-3-yl
162	COEt	2-C(=NOMe)Me	5-CF ₂ CF ₂ CF ₃ -4-Me 114
			-1,2,4-Tria-3-yl
163	COEt	H	5-CF ₂ CF ₃ -4-Me 131
			-1,2,4-Tria-3-yl
164	H	2-COOMe	5-CF ₂ CF ₃ -4-Me 99-100
			-1,2,4-Tria-3-yl
165	COEt	2-COOMe	5-CF ₂ CF ₃ -4-Me 114
			-1,2,4-Tria-3-yl
166	H	2-COMe	5-CF ₂ CF ₃ -4-Me 65-67
			-1,2,4-Tria-3-yl
167	H	2-C(=NOMe)Me	5-CF ₂ CF ₃ -4-Me 64-67
			-1,2,4-Tria-3-yl
168	COEt	2-C(=NOMe)Me	5-CF ₂ CF ₃ -4-Me 114
			-1,2,4-Tria-3-yl
169	H	H	1-Me-3-CF ₃ -Pyra-5-yl 112-114
170	H	H	1-Me-3-CF ₃ -4-Cl- 135-137
			Pyra-5-yl
171	H	H	1-Me-5-CF ₃ -3-Cl- 127-129
			Pyra-5-yl
172	H	H	1-Me-4-Cl-5-CF ₃ - 139-141
			Pyra-5-yl
173	H	H	5-Me-Isoxa-3-yl

上記表1において、好適には、1、3、16、41、43、61、62、109、113、114、131、156、157、158、159番の化合物を挙げることができ、更に好適には、1、3、41、43、61、109、113、156、157番の化合物を挙げることができ、最も好適には、3、41番の化合物を挙げることができる。

【0031】表1の化合物の、化合物番号、化合物名及び核磁気共鳴スペクトルを以下に示す。なお、[NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm)] は、それぞれ省略する。

【0032】化合物番号1

N-[4-(2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフ*50

*ルオロメタンスルホンアミド

40 8.47(s, 1H), 8.32(d, 1H, J=2.5Hz), 8.14(s, 1H), 7.32(d, 2H, J=8.8Hz), 7.18(d, 2H, J=8.8Hz).

化合物番号3

N-[4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.48(br.s, 1H), 8.31(s, 2H), 7.35(d, 2H, J=8.1Hz), 7.20(d, 2H, J=8.1Hz).

化合物番号4

N-[4-(3,6-ジメチル-2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.02(s, 1H), 7.33(d, 2H, J=9.0Hz), 7.14(d, 2H, J=9.0H

19

z), 2.54(s, 3H), 2.35(s, 3H).

化合物番号5

N-[4-(5, 6-ジフェニル-2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.41(s, 2H), 7.21-7.41(m, 14H).

化合物番号6

N-[4-(3-クロロ-5, 6-ジフェニル-2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.16-7.51(m, 14H).

化合物番号7

N-[4-[5, 6-ジフェニル-3-(2-エトキシカルボニル)エチル-2-ピラジニルオキシ]フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.63(s, 1H), 7.38-7.43(m, 2H), 7.14-7.32(m, 12H), 4.18(q, 2H, J=7.2Hz), 3.37(t, 2H, J=7.0Hz), 2.98(t, 2H, J=7.0Hz), 1.25(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号14

N-[4-(3-メトキシ-2-キノキサリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.82(dd, 1H, J=1.5, 8.8Hz), 7.65(dd, 1H, J=1.5, 7.7Hz), 7.42-7.50(m, 2H), 7.36-7.41(m, 5H), 4.22(s, 3H).

化合物番号15

N-[4-(3-クロロ-2-キノキサリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.95-8.07(m, 1H), 7.75-7.83(m, 1H), 7.64-7.73(m, 3H), 7.51(s, 4H).

化合物番号16

N-[3-メチル-4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.20-8.33(m, 3H), 7.06-7.29(m, 3H), 2.19(s, 3H).

化合物番号17

N-[2, 3-ジメチル-4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.29(s, 2H), 7.28(d, 1H), 7.27(br.s, 1H), 6.97(d, 1H), 2.36(s, 3H), 2.15(s, 3H).

化合物番号18

N-[2, 5-ジメチル-4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.28(s, 2H), 7.84(s, 1H), 7.31(s, 1H), 6.97(s, 1H), 2.35(s, 3H), 2.15(s, 3H).

化合物番号19

N-[4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)-1-ナフチル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.39(d, 2H, J=14.0Hz), 8.12(d, 1H, J=8.1Hz), 8.03

20

(d, 1H, J=8.8Hz), 7.57-7.78(m, 4H), 7.29(d, 2H, J=8.1Hz).

化合物番号20

N-[3, 5-ジクロロ-4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.46(s, 1H), 8.35(s, 1H), 7.40(s, 2H).

化合物番号21

N-[4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)-2, 6-ジブromoフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.44(s, 1H), 8.36(s, 1H), 7.58(s, 2H).

化合物番号23

N-[4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.34(s, 1H), 8.31(s, 1H), 7.89(d, 1H, J=2.8Hz), 7.81(d, 1H, J=9.1Hz), 7.42(dd, 1H, J=9.1, 2.8Hz), 3.97(s, 3H).

20 化合物番号24

N-[4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)-2-(1-メトキシイミノエチル)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

11.76(brs, 1H), 8.33(s, 2H), 7.72(d, 1H, J=9.0Hz), 7.34(brs, 1H), 7.17(d, 1H, J=9.0Hz), 4.04(s, 3H), 2.29(s, 3H).

化合物番号25

N-[4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)-2-(1-メトキシイミノエチル)フェニル]-N-プロ30 ピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

8.39(s, 2H), 7.40-7.26(m, 3H), 3.94(s, 3H), 2.58-2.27(m, 2H), 2.20(s, 3H), 1.12(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号27

N-[4-(6-クロロ-2-ピラジニルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

8.40(s, 2H), 7.95(d, 1H, J=2.8Hz), 7.52(dd, 1H, J=8.7, 2.8Hz), 7.39(d, 1H, J=8.7Hz), 3.92(s, 3H), 2.53(q, 2H, J=7.2Hz), 1.17(t, 3H, J=7.2Hz).

40 化合物番号28

N-[4-(5, 6-ジフェニル-3-フェニルチオピラジニルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.94(br. s, 1H), 7.56-7.73(m, 3H), 7.31-7.48(m, 4H), 7.05-7.30(m, 10H), 3.83(s, 3H).

化合物番号29

N-[4-(5, 6-ジフェニル-3-メチルチオピラジニルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

50 7.92(d, 1H, J=2.8Hz), 7.64(d, 1H, J=9.0Hz), 7.09-

21

7.50 (m, 1H), 3.78(s, 3H), 2.63 (s, 3H).

化合物番号30

N-[4-(5, 6-ジフェニル-3-プロピルチオピラジニルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.93 (d, 1H, J=2.8Hz), 7.66 (d, 1H, J=9.5Hz), 7.35-7.48 (m, 3H), 7.09-7.32 (m, 8H), 3.81 (s, 3H), 3.26 (t, 2H, J=7.3Hz), 1.81 (hexatet, 2H, J=7.3Hz), 1.09 (t, 3H, J=7.3Hz).

化合物番号37

N-[4-(6-メトキシ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.41 (s, 1H), 7.29 (d, 2H, J=8.9Hz), 7.08 (d, 2H, J=8.9Hz), 6.13 (s, 1H), 3.96 (s, 3H).

化合物番号38

N-[4-(2-エトキシ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.37 (d, 1H, J=6.0Hz), 7.33 (d, 2H, J=8.9Hz), 7.17 (d, 2H, J=8.9Hz), 6.53 (d, 1H, J=6.0Hz), 4.27 (q, 2H, J=7.2Hz), 1.31 (t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号39

N-[4-(2-メチルチオ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.29 (d, 1H, J=5.6Hz), 7.28 (d, 2H, J=8.9Hz), 7.09 (d, 2H, J=8.9Hz), 6.49 (d, 1H, J=5.6Hz), 2.28 (s, 3H).

化合物番号41

N-[4-(6-エトキシ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.45 (s, 1H), 7.28 (d, 2H, J=8.9Hz), 7.14 (d, 2H, J=8.9Hz), 6.20 (s, 1H), 4.44 (q, 2H, J=7.1Hz), 1.41 (t, 3H, J=7.1Hz).

化合物番号42

N-[4-(2-クロロ-6-フルオロ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.39 (d, 1H, J=2.1Hz), 7.38 (d, 2H, J=9.0Hz), 7.27 (d, 2H, J=9.0Hz).

化合物番号43

N-[4-(6-イソプロポキシ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.45 (s, 1H), 7.24 (d, 2H, J=8.9Hz), 7.12 (d, 2H, J=8.9Hz), 6.15 (s, 3H), 5.38 (heptet, 1H, J=6.1Hz), 1.31 (d, 6H, J=6.1Hz).

化合物番号44

22

N-[4-(6-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.46 (s, 1H), 7.32 (d, 2H, J=8.9Hz), 7.16 (d, 2H, J=8.9Hz), 6.36 (s, 1H), 4.84 (q, 2H, J=8.4Hz).

化合物番号57

N-[4-(4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.72 (s, 1H), 8.54 (d, 1H, J=5.9Hz), 7.30 (d, 2H, J=9.0Hz), 7.10 (d, 2H, J=9.0Hz)

化合物番号58

N-[4-(2-クロロ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.78 (br. s, 1H), 8.48 (d, 1H, J=5.9Hz), 7.39 (d, 2H, J=8.8Hz), 7.18 (d, 2H, J=8.8Hz), 6.87 (d, 1H, J=5.9Hz).

化合物番号59

N-[4-(6-クロロ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.59(s, 1H), 7.91(br. s, 1H), 7.36(d, 2H, J=8.8Hz), 7.18(d, 2H, J=8.8Hz), 6.99(s, 1H).

化合物番号61

N-[4-(2, 6-ジメトキシ-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.76(br. s, 1H), 7.23(d, 2H, J=9.0Hz), 7.09(d, 2H, J=9.0Hz), 5.85(s, 1H), 3.98(s, 3H), 3.91(s, 3H).

化合物番号62

N-[4-(2-クロロ-6-メチル-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.36(d, 2H, J=8.9Hz), 7.19(d, 2H, J=8.9Hz), 6.68(s, 1H), 2.51(s, 3H).

化合物番号63

N-[4-(6-クロロ-2-メチルチオ-5-フェニル-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.40-7.52(m, 5H), 7.31(d, 2H, J=8.9Hz), 7.13(d, 2H, J=8.9Hz), 6.79(br. s, 1H), 2.05(s, 3H).

化合物番号64

N-[4-(5-クロロ-6-エチル-4-ビリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.47 (s, 1H), 7.38 (d, 2H, J=9.1Hz), 7.23 (d, 2H, J=9.1Hz), 2.99 (q, 2H, J=7.5Hz), 1.32 (t, 3H, J=7.5Hz).

化合物番号65

N-[4-(2-メトキシ-4-ピリミジニルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.38 (d, 1H, J=5.4Hz), 7.32 (d, 2H, J=8.8Hz), 7.13 (d, 2H, J=8.8Hz), 6.57 (d, 1H, J=5.4Hz), 3.88 (s, 3H).

化合物番号66

N-[4-(2-フェニル-4-キナゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.27-8.40 (m, 3H), 8.09 (d, 1H, J=8.7Hz), 7.92 (dt, 1H, Jd=1.5Hz, Jt=7.7Hz), 7.63 (dt, 1H, Jd=1.5Hz, Jt=7.7Hz), 7.36-7.49 (m, 7H).

化合物番号68

N-[4-(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.33(br.s), 7.11(d, 2H, J=8.9Hz), 6.82(d, 2H, J=8.9Hz).

化合物番号69

N-[4-(4,6-ジクロロ-1,3,5-トリアジン-2-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.70(br.s), 7.40(d, 2H, J=9.3Hz), 7.31(d, 2H, J=9.3Hz).

化合物番号73

N-[4-(4,5-ジフェニル-2-オキサゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.23-7.63(m, 14H).

化合物番号77

N-[4-(2-ベンゾキサゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.59-7.66(m, 1H), 7.44-7.51(m, 1H), 7.26-7.39(m, 4H), 7.19(d, 2H, J=9.1Hz).

化合物番号78

N-[4-(2-ベンズチアゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.58-7.68(m, 2H), 7.19-7.39(m, 6H).

化合物番号80

N-[4-(1-メチル-5-テトラゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.26(brs, 1H), 7.34(d, 2H, J=9.1Hz), 7.27(d, 2H, J=9.1Hz), 4.01(s, 3H).

化合物番号81

N-[4-(4-クロロ-1,2,5-チアジアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.37(d, 2H, J=9.1Hz), 7.33(d, 2H, J=9.1Hz)

化合物番号87

N-[4-(3-フェニル-1,2,4-チアジアゾール-5-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンス

ルホンアミド

8.17-8.12(m, 2H), 7.45-7.33(m, 7H).

化合物番号90

N-[4-(3-フェニルチオキノキサリン-2-イルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.84 (d, 1H, J=2.8Hz), 7.28-7.74 (m, 11H), 3.87(s, 3H).

化合物番号103

10 N-[4-(2-チアゾリルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.03 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.82 (d, 1H, J=9.2Hz), 7.54 (dd, 1H, J=2.9, 9.2Hz), 7.24 (d, 1H, J=5.8Hz), 6.89 (d, 1H, J=5.8Hz), 3.98 (s, 3H).

化合物番号104

N-[4-(2-チアゾリルオキシ)-2-(1-メトキシイミノエチル)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.65 (d, 1H, J=8.9Hz), 7.40 (d, 1H, J=6.4Hz), 7.18-7.26 (m, 1H), 6.91 (d, 1H, J=2.8Hz), 6.77 (dd, 1H, J=2.8, 8.9Hz), 3.97 (s, 3H), 2.21 (s, 3H).

化合物番号105

N-[4-(2-チアゾリルオキシ)-3-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.71 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.43 (dd, 1H, J=2.9, 8.8Hz), 7.17 (d, 1H, J=8.8Hz), 7.08 (d, 1H, J=3.7Hz), 6.76 (d, 1H, J=3.7Hz), 3.09 (s, 3H).

化合物番号107

N-[4-(5-ニトロ-2-チアゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.12(s, 1H), 7.32(s, 4H).

化合物番号108

N-[4-(5-ニトロ-2-チアゾリルオキシ)フェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

8.11(s, 1H), 7.50(d, 2H, J=9.0Hz), 7.42(d, 2H, J=9.0Hz), 2.42(q, 2H, J=7.2Hz), 1.15(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号109

N-[4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチル-2-チアゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.11(brs, 1H), 7.40-7.28(m, 4H), 6.85(t, 1H, J=5.9Hz).

50

化合物番号110

N-[4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチル-2-チアゾリルオキシ)フェニル]-N-プロピオニトリフルオロメタンスルホンアミド

7.49(d, 2H, J=9.1Hz), 7.40(d, 2H, J=9.1Hz), 6.88(t, 1H, J=53.9Hz), 2.38(q, 2H, J=7.2Hz), 1.13(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号111

N-[4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチル-2-チアゾリルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

11.27(brs, 1H), 8.02(d, 1H, J=2.9Hz), 7.85(d, 1H, J=9.2Hz), 7.55(dd, 1H, J=9.2, 2.9Hz), 6.86(t, 1H, J=53.9Hz), 3.99(s, 3H).

化合物番号113

N-[4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチル-2-チアゾリルオキシ)-2-(1-メトキシイミノエチル)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.74(d, 1H, J=9.2Hz), 7.42(d, 1H, J=2.9Hz), 7.30(d, 1H, J=9.2, 2.9Hz), 6.85(t, 1H, J=53.9Hz), 4.04(s, 3H), 2.29(s, 3H).

化合物番号114

N-[4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチル-2-チアゾリルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]-N-プロピオニトリフルオロメタンスルホンアミド

8.07(d, 1H, J=2.9Hz), 7.68(dd, 1H, J=8.8, 2.9Hz), 7.41(d, 1H, J=8.8Hz), 6.88(t, 1H, J=53.9Hz), 3.94(s, 3H), 2.56(q, 2H, J=7.3Hz), 1.17(t, 3H, J=7.3Hz).

化合物番号119

N-[4-(5-エトキシカルボニル-4-メチル-2-チアゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.36(d, 2H, J=9.2Hz), 7.26(d, 2H, J=9.2Hz), 4.29(q, 2H, J=7.1Hz), 2.59(s, 3H), 1.32(t, 3H, J=7.1Hz).

化合物番号120

N-[4-(5-エトキシカルボニル-4-メチル-2-チアゾリルオキシ)フェニル]-N-プロピオニトリフルオロメタンスルホンアミド

7.47(d, 2H, J=9.0Hz), 7.37(d, 2H, J=9.0Hz), 4.30(q, 2H, J=7.2Hz), 2.60(s, 3H), 2.36(q, 2H, J=7.3Hz), 1.34(t, 3H, J=7.2Hz), 1.12(t, 3H, J=7.3Hz).

化合物番号121

N-[4-(5-エトキシカルボニル-4-トリフルオロメチル-2-チアゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.38(d, 2H, J=8.8Hz), 7.35(d, 2H, J=8.8Hz), 4.36(q, 2H, J=7.1Hz), 1.36(t, 3H, J=7.1Hz).

化合物番号122

N-[4-(5-エトキシカルボニル-4-トリフルオロメチル-2-チアゾリルオキシ)フェニル]-N-プロピオニトリフルオロメタンスルホンアミド

7.53(d, 2H, J=9.0Hz), 7.41(d, 2H, J=9.0Hz), 4.38(q, 2H, J=7.1Hz), 2.39(q, 2H, J=7.2Hz), 1.38(t, 3H, J=7.1Hz), 1.14(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号123

N-[4-(5-メトキシカルボニル-4-メチル-2-チアゾリルオキシ)フェニル]-N-プロピオニトリフルオロメタンスルホンアミド

7.47(d, 2H, J=9.1Hz), 7.37(d, 2H, J=9.1Hz), 3.84(s, 3H), 2.61(s, 3H), 2.36(q, 2H, J=7.2Hz), 1.12(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号124

N-[4-(5-メトキシカルボニル-4-メチル-2-チアゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.36(d, 2H, J=9.1Hz), 7.26(d, 2H, J=9.1Hz), 3.82(s, 3H), 2.58(s, 3H).

化合物番号125

N-[4-(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イルオキシ)-3-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.38(d, 1H, J=2.9Hz), 7.97(dd, 1H, J=9.0, 2.9Hz), 7.86(brs, 1H), 7.29(d, 1H, J=9.0Hz), 4.04(s, 6H), 3.97(s, 3H).

化合物番号126

N-[4-(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イルオキシ)-2-メトキシカルボニルフェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.81(d, 1H, J=2.8Hz), 7.70(d, 1H, J=9.1Hz), 7.33(d, 1H, J=9.1, 2.8Hz), 3.97(s, 6H), 3.88(s, 3H).

化合物番号131

N-[4-(2,5-ジメチル-3-ピラゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.28(d, 2H, J=9.2Hz), 7.09(d, 2H, J=9.2Hz), 5.49(s, 1H), 3.64(s, 3H), 2.21(s, 3H).

化合物番号133

N-[4-(4-シアノ-2-メチル-5-トリフルオロメチル-3-ピラゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.34(d, 2H, J=9.1Hz), 7.17(d, 2H, J=9.1Hz), 3.87(s, 3H).

化合物番号134

N-[4-(4-クロロ-2,5-ジメチル-3-ピラゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.28(d, 2H, J=9.1Hz), 6.97(d, 2H, J=9.1Hz), 3.62(s, 3H), 2.21(s, 3H).

27

化合物番号139

N-[4-(1-エチル-3,5-ジメチル-4-ピラゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.18(d, 2H, J=9.0Hz), 6.84(d, 2H, J=9.0Hz), 4.03(q, 2H, J=7.3Hz), 2.09(s, 3H), 1.93(s, 3H), 1.37(t, 3H, J=7.3Hz).

化合物番号140

N-[4-(4-メチル-5-フェニル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.58-7.52(m, 2H), 7.49-7.45(m, 3H), 7.29(s, 4H), 3.58(s, 3H).

化合物番号141

N-[4-(4-メチル-5-フェニル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

7.68-7.64(m, 4H), 7.55-7.51(m, 3H), 7.37(d, 2H, J=9.0Hz), 3.65(s, 3H), 2.33(q, 2H, J=7.2Hz), 1.11(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号142

N-[2-メトキシカルボニル-4-(4-メチル-5-フェニル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.29(d, 1H, J=2.9Hz), 7.83(d, 1H, J=9.8Hz), 7.69-7.65(m, 3H), 7.54-7.52(m, 3H), 3.97(s, 3H), 3.65(s, 3H).

化合物番号143

N-[2-メトキシカルボニル-4-(4-メチル-5-フェニル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

8.24(d, 1H, J=3.0Hz), 7.93(dd, 1H, J=8.8, 3.0Hz), 7.65-7.72(m, 2H), 7.54-7.51(m, 3H), 7.40(d, 1H, J=8.8Hz), 3.94(s, 3H), 3.67(s, 3H), 2.48(q, 2H, J=7.1Hz), 1.15(t, 3H, J=7.1Hz).

化合物番号144

N-[4-(2-メチル-5-フェニル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.88-7.93(m, 2H), 7.28-7.36(m, 7H), 3.77(s, 3H).

化合物番号145

N-[4-(2-メチル-5-フェニル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

8.05-8.00(m, 2H), 7.60(d, 2H, J=8.7Hz), 7.42-7.25(m, 5H), 3.85(s, 3H), 2.34(q, 2H, J=7.3Hz), 1.13(t, 3H, J=7.3Hz).

化合物番号146

N-[4-(4-メチル-5-トリフルオロメチル-

28

1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.25(s, 4H), 3.62(s, 3H).

化合物番号147

N-[4-(4-メチル-5-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

7.60(d, 2H, J=9.0Hz), 7.38(d, 2H, J=9.0Hz), 3.72(s, 3H), 2.32(q, 2H, J=7.2Hz), 1.09(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号148

N-[2-メトキシカルボニル-4-(4-メチル-5-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

11.22(brs, 1H), 8.20(d, 1H, J=2.9Hz), 7.79(d, 1H, J=9.4Hz), 7.64(dd, 1H, J=9.4, 2.9Hz), 3.96(s, 3H), 3.72(s, 3H).

20 化合物番号149

N-[2-メトキシカルボニル-4-(4-メチル-5-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

8.18(d, 1H, J=3.0Hz), 7.83(dd, 1H, J=8.8, 3.0Hz), 7.40(d, 1H, J=8.8Hz), 3.89(s, 3H), 3.72(s, 3H), 2.45(q, 2H, J=7.2Hz), 1.11(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号150

30 N-[2-アセチル-4-(4-メチル-5-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

8.01(d, 1H, J=2.7Hz), 7.68(d, 1H, J=9.2Hz), 7.48(d, 1H, J=9.2, 2.7Hz), 3.71(s, 3H), 2.61(s, 3H).

化合物番号151

N-[2-(1-メトキシイミノエチル)-4-(4-メチル-5-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.67-7.72(m, 2H), 7.35(dd, 1H, J=9.1, 2.7Hz), 4.02(s, 3H), 3.72(s, 3H), 2.29(s, 3H).

化合物番号152

N-[2-(1-メトキシイミノエチル)-4-(4-メチル-5-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

7.68(d, 1H, J=2.9Hz), 7.58(dd, 1H, J=8.8, 2.9Hz), 7.39(d, 1H, J=8.8Hz), 3.93(s, 3H), 3.75(s, 3H), 2.55-2.11(m, 2H), 2.20(s, 3H), 1.10(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号153

50 N-[4-(5-ジフルオロメチル-4-メチル-1,

29

2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] トリフルオロメタンスルホンアミド

7.26(s, 4H), 6.72(t, 1H, J=51.7Hz), 3.66(s, 3H).

化合物番号154

N-[4-(5-ジフルオロメチル-4-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] -N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

7.61(d, 2H, J=8.9Hz), 7.39(d, 2H, J=8.9Hz), 6.84(t, 1H, J=51.8Hz), 3.76(s, 3H), 2.34(q, 2H, J=7.3Hz), 1.12(t, 3H, J=7.3Hz).

化合物番号155

N-[4-(4-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] トリフルオロメタンスルホンアミド

7.32(s, 4H), 3.71(s, 3H).

化合物番号156

N-[4-(5-(1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピル)-4-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] トリフルオロメタンスルホンアミド

7.28(s, 4H), 3.66(s, 3H).

化合物番号157

N-[4-(5-(1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピル)-4-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] -N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

7.49(d, 2H, J=9.0Hz), 7.31(d, 2H, J=9.0Hz), 3.64(s, 3H), 2.22(q, 2H, J=7.2Hz), 0.98(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号158

N-[4-(5-(1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピル)-4-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ)-2-メトキシカルボニル フェニル] トリフルオロメタンスルホンアミド

11.24(bris, 1H), 8.27(d, 1H, J=2.9Hz), 7.86(d, 1H, J=9.3Hz), 7.65(dd, 1H, J=9.3, 2.9Hz), 3.99(s, 3H), 3.74(s, 3H).

化合物番号159

N-[4-(5-(1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピル)-4-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ)-2-メトキシカルボニル フェニル] -N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

8.21(d, 1H, J=2.9Hz), 7.86(dd, 1H, J=8.8, 2.9Hz), 7.41(d, 1H, J=8.8Hz), 3.91(s, 3H), 3.74(s, 3H), 2.

30

48(q, 2H, J=7.2Hz), 1.13(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号160

N-[2-アセチル-4-(5-(1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピル)-4-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] トリフルオロメタンスルホンアミド

12.05(bris, 1H), 8.29(d, 1H, J=2.8Hz), 7.85(d, 1H, J=9.1Hz), 7.63(dd, 1H, J=9.1, 2.8Hz), 3.76(s, 3H), 2.72(s, 3H).

10

化合物番号161

N-[4-(5-(1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピル)-4-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ)-2-(1-メトキシイミノエチル) フェニル] トリフルオロメタンスルホンアミド

11.83(bris, 1H), 7.78-7.71(m, 2H), 7.39(dd, 1H, J=9.0, 2.8Hz), 4.04(s, 3H), 3.73(s, 3H), 2.31(s, 3H).

化合物番号162

20

N-[4-(5-(1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピル)-4-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ)-2-(1-メトキシイミノエチル) フェニル] -N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

7.70(d, 1H, J=2.9Hz), 7.59(dd, 1H, J=8.8, 2.9Hz), 7.38(d, 1H, J=8.8Hz), 3.92(s, 3H), 3.75(s, 3H), 2.54-2.10(m, 2H), 2.20(s, 3H), 1.09(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号163

N-[4-(4-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] -N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

7.62(d, 2H, J=9.0Hz), 7.39(d, 2H, J=9.0Hz), 3.75(s, 3H), 2.33(q, 2H, J=7.2Hz), 1.10(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号164

N-[2-メトキシカルボニル-4-(4-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] トリフルオロメタンスルホンアミド

40

8.22(d, 1H, J=2.9Hz), 7.79(d, 1H, J=9.3Hz), 7.63(d, 1H, J=9.3, 2.9Hz), 3.95(s, 3H), 3.73(s, 3H).

化合物番号165

N-[2-メトキシカルボニル-4-(4-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ) フェニル] -N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

8.20(d, 1H, J=3.0Hz), 7.84(dd, 1H, J=8.8, 3.0Hz), 7.40(d, 1H, J=8.8Hz), 3.90(s, 3H), 3.75(s, 3H), 2.

50

31

46(q, 2H, J=7.2Hz), 1.11(t, 3H, J=7.2Hz).

化合物番号166

N-[2-アセチル-4-(4-メチル-5-(1, 1, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

12.04(brs, 1H), 8.28(d, 1H, J=2.8Hz), 7.84(d, 1H, J=9.4Hz), 7.62(dd, 1H, J=9.4, 2.8 Hz), 3.77(s, 3H), 2.71(s, 3H).

化合物番号167

N-[2-(1-メトキシイミノエチル)-4-(4-メチル-5-(1, 1, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

11.83(brs, 1H), 7.79(d, 1H, J=2.8Hz), 7.74(d, 1H, J=9.1Hz), 7.39(dd, 1H, J=9.1, 2.8Hz), 4.05(s, 3H), 3.75(s, 3H), 2.32(s, 3H).

化合物番号168

N-[2-(1-メトキシイミノエチル)-4-(4-メチル-5-(1, 1, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-1, 2, 4-トリアゾール-3-イルオキシ)フェニル]-N-プロピオニルトリフルオロメタンスルホンアミド

7.70(d, 1H, J=2.9Hz), 7.58(dd, 1H, J=8.8, 2.9Hz), 7.38(d, 1H, J=8.8Hz), 3.92(s, 3H), 3.76(s, 3H), 2.54-2.10(m, 2H), 2.19(s, 3H), 1.09(t, 3H, J=7.0Hz).

化合物番号169

32

N-[4-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.34(d, 2H, J=9.0Hz), 7.15(d, 2H, J=9.0Hz), 5.91(s, 1H), 3.81(s, 3H).

化合物番号170

N-[4-(4-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

10 7.32(d, 2H, J=9.1Hz), 7.00(d, 2H, J=9.1Hz), 3.77(s, 3H).

化合物番号171

N-[4-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-3-ピラゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

7.23(d, 2H, J=9.0Hz), 7.06(d, 2H, J=9.0Hz), 6.19(s, 1H), 3.92(s, 3H).

化合物番号173

N-[4-(5-メチル-3-イソオキサゾリルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド

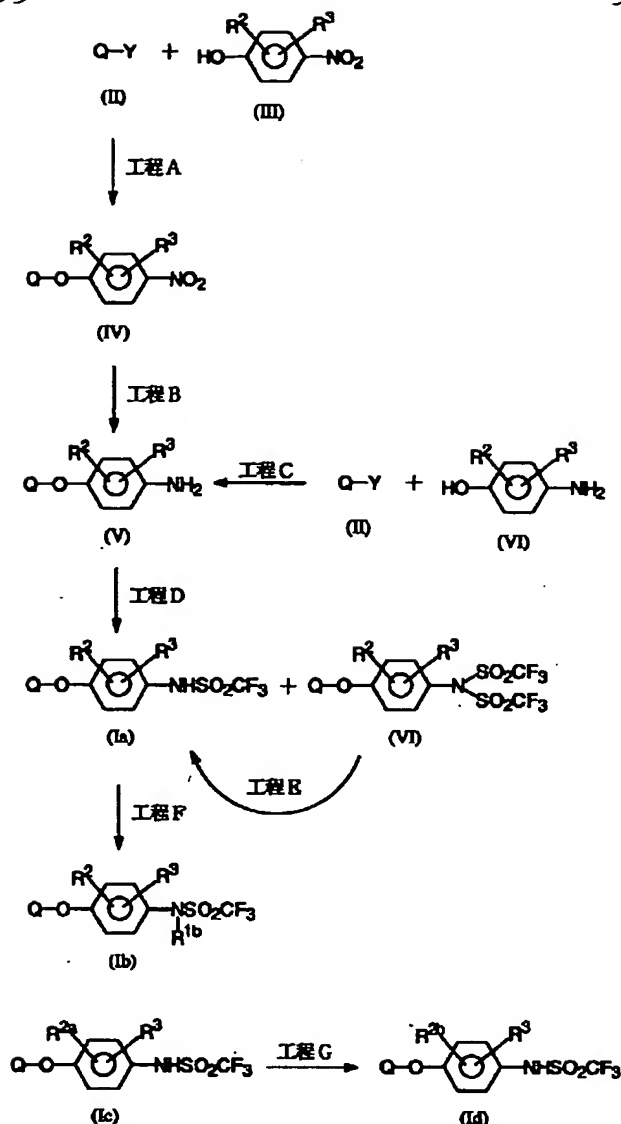
20 7.17(s, 4H), 5.84(d, 1H, J=0.9Hz), 2.41(s, 3H).

【0033】

【発明の実施の形態】本発明の一般式(I)で表わされる化合物は、以下に示す工程により製造される。

【0034】

【化4】



【0035】式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び Q は、前記と同意義を示し、 Y は、ハロゲン原子又はメタンスルホニル基のような脱離基を示し、 R^{1b} は、前記した R^1 から水素原子を除いた基を示し、 R^{2a} は、アセチル基を示し、 R^{2b} は、式 $-C(=NOCH_3)CH_3$ で表わされる基を示す。

【0036】以下、これらの一般的製造方法について更に詳しく説明する。

【0037】(工程A)本工程は、化合物(III)と、脱離基 Y を有する化合物(II)とを、溶媒の存在下又は非存在下、塩基を用いて置換反応することにより、一般式(IV)で示されるエーテルを製造する工程である。

【0038】本工程で用いられる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジエチルイソプロピルアミン、ピリジン、1,4-ジアザビシクロ*50

*[2,2,2]オクタン、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]ウンデセンのような有機三級アミン類、水素化ナトリウム、水素化カルシウム、ナトリウム、リチウム、 n -ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド、ナトリウムメトキシド、セーブトキシカリウムなどのアルカリ金属塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどの無機塩基類であり、好適には、水素化ナトリウムやリチウムビス(トリメチルシリル)アミド、炭酸カリウムである。

【0039】塩基の使用量は、化合物(II)に対して通常1~20倍当量、好適には1.2~5倍当量である。

【0040】反応は、好適には溶媒の存在下で行なわれる。使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、好適に

は、ヘキサン、石油エーテル、ベンゼン、トルエンのような炭化水素類、クロロホルム、塩化メチレンのようなハロゲン化炭化水素類、エチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類、N、N-ジメチルホルムアミドのようなアミド類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類及びアセトニトリルのようなニトリル類並びにこれらの溶媒の混合物等であり、好適には、N、N-ジメチルホルムアミドである。

【0041】反応温度は、通常-70〜90℃であり、好適には20〜60℃である。反応時間は、主に反応温度、原料化合物、反応試薬又は使用される溶媒の種類によって異なるが、通常15分〜昼夜であり、好適には、15分〜4時間である。

【0042】(工程B)本工程は、化合物(IV)のニトロ基をアミノ基に還元して、化合物(V)を製造する工程であり、ニトロ基の還元通常使用される方法を用いることができる。

【0043】そのような例のひとつとして、貴金属触媒を使用した接触還元をあげることができる。反応に使用する触媒として好適なものは、例えば、パラジウム-炭素、パラジウム-硫酸バリウム、酸化白金等をあげることができる。

【0044】反応に使用する溶媒に好適なものとしては、例えばメタノール、エタノールのようなアルコール類：テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類：または酢酸エチルのようなエステル類をあげることができる。

【0045】反応温度は好適には10℃乃至80℃であり、反応時間は通常10分間乃至5時間程度である。

【0046】もうひとつの好適な還元方法として、酢酸溶媒下の亜鉛末や鉄粉による還元をあげることができる。反応温度は、好適には0℃乃至室温であり、反応時間は通常10分間乃至2時間程度である。

【0047】さらに、還元方法として、塩化スズ(II)-水素化ホウ素ナトリウムを用いることもできる。反応に使用する溶媒に好適なものとしては、例えばメタノール、エタノールのようなアルコール類をあげることができる。反応温度は、好適には10℃乃至80℃であり、反応時間は通常10分間乃至5時間程度である。使用される塩化スズ(II)の量は、化合物(IV)に対して通常4〜20当量、好適には5〜7当量であり、水素化ホウ素ナトリウムの量は通常0.2〜1当量、好適には0.5当量である。

【0048】(工程C)本工程は、化合物(VI)と化合物(II)を、溶媒の存在下又は非存在下、塩基を用いる置換反応により、一般式(V)で示されるエーテルを製造する工程である。本工程は、工程Aと同様の方法により行なうことができる。

【0049】(工程D)本工程は、前記化合物(V)を原料として、溶媒の存在下並びに反応助剤の存在下、ト

リフルオロメタンスルホン酸の反応性誘導体と反応することにより、本発明の化合物(Ia)と(VI)を製造する工程である。

【0050】本工程に使用される反応助剤は、通常塩基性がよく、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジエチルイソプロピルアミン、ピリジン、1,4-ジアザビシクロ[2,2,2]オクタン、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセンのような有機三級アミン類や、水素化ナトリウム、水素化カルシウム、ナトリウム、リチウム、n-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド、t-ブトキシカリウムなどのアルカリ金属塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどの無機塩基であり、好適には、トリエチルアミンやピリジンなどの有機三級アミン類である。

【0051】トリフルオロメタンスルホン酸の反応性誘導体として適当なものは、例えば、酸ハロゲン化物や酸無水物であり、好適には、酸クロライド、酸フルオリド、酸無水物である。

【0052】反応助剤の使用量は、化合物(V)に対して通常1〜20倍当量、好適には1.1〜2.5倍当量であり、トリフルオロメタンスルホン酸の反応性誘導体の使用量は、化合物(V)に対して通常1〜20倍当量、好適には1.1〜2.5倍当量である。

【0053】反応は、好適には溶媒の存在下で行なわれ、使用される溶媒としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、好適には、ヘキサン、石油エーテル、ベンゼン、トルエンのような炭化水素類、クロロホルム、塩化メチレンのようなハロゲン化炭化水素類、エチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類、N、N-ジメチルホルムアミドのようなアミド類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類及びアセトニトリルのようなニトリル類並びにこれらの溶媒の混合物であり、更に好適には塩化メチレン、N、N-ジメチルホルムアミドである。

【0054】反応温度は、通常、-70〜150℃であり、好適には-20℃〜120℃である。反応時間は、主に反応温度、原料化合物、反応試薬又は使用される溶媒の種類によって異なるが、通常15分〜昼夜であり、好適には15分〜3時間である。

【0055】本工程においては、通常化合物(Ia)と化合物(VI)が同時に生成される。その比率は、反応条件、特に原料である化合物(V)の反応性及びトリフルオロメタンスルホン酸の反応性誘導体の量と種類により大幅に変わりうる。

【0056】例えば、トリフルオロメタンスルホン酸無水物を化合物(V)に対して、1.0〜1.2当量用いて、-20〜0℃の低温で反応を行なえば、通常化合物

37

(I)を主生成物として取得できる。一方、トリフルオロメタンスルホン酸無水物を化合物(V)に対して、2.5〜3.0当量用いて、室温で反応を行なえば、通常化合物(VI)を主生成物として取得できる。

【0057】化合物(Ia)の取得を目的とする場合には、それ故、本工程の反応物(通常は、前述のとおり、化合物(Ia)と(VI)の混合物)を、単離もしくは単離することなしに、後述する加水分解反応である工程Eに付して、その全量を化合物(Ia)とすることができる。化合物(VI)の取得を目的とする場合には、

本工程の反応物を、カラムクロマトグラフィー等の通常の精製方法で、分離・精製すればよい。

【0058】(工程E)本工程は、前記工程Dの反応混合物を単離し、もしくは単離することなく、本工程の加水分解反応に付し、化合物(Ia)を製造する工程である。

【0059】加水分解反応は、塩基の存在下に溶媒中で行なわれる。使用される塩基としては、好適には、酢酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムをあげることができる。

【0060】溶媒は反応に関与しないものであれば、特に限定はなく、例えばメタノール、エタノール、プロパノールのようなアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、2-メトキシエチルエーテルのようなエーテル類、及び水並びにこれらの溶媒の混合物が使用される。

【0061】反応温度及び反応時間に特に限定はなく、通常-10℃乃至100℃、好適には0℃乃至50℃で、30分乃至15時間、好適には30分間乃至8時間である。

【0062】(工程F)本工程は、式(Ia)の化合物を、式R^{1b}OHで表わされるカルボン酸若しくはその反応性誘導体と反応させることによりアミド結合を形成し、式(Ib)の化合物を製造する工程である。

【0063】本工程は、式(Ia)のスルホンアミドのアミノ基とカルボン酸R^{1b}OHとのアミド化反応であって、それ故、アミド化反応としてそれ自体知られた公知の方法によって行われる。

【0064】カルボン酸R^{1b}OHの反応性誘導体としては、例えば、酸ハライド(酸クロリド、酸ブロミド等)、酸無水物、混合酸無水物、活性エステル(例えば、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルエステル)、活性アミド等、アミド化に通常用いられるものが挙げられる。

【0065】式R^{1b}OHのカルボン酸の酸ハライドを用いる場合、反応は好適には、塩基の存在下で行われる。好適な塩基としては、例えば、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、1,5-ジアザビシクロ[4,3,0]ノナ

38

ン-5(DBN)又は1,8-ジアザビシクロ[4,3,0]ウンデセン-7(DBU)のような有機塩基をあげることができる。

【0066】カルボン酸R^{1b}OHの酸ハライドは、化合物(Ia)に対して通常1乃至20当量、好適には、2乃至10当量、塩基は、通常1乃至20当量、好適には、2乃至10当量使用される。

【0067】反応は、通常は不活性溶媒中で行なわれ、その様な溶媒としては、例えば、ヘキサン、石油エーテル、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類、クロロホルム、塩化メチレン、o-ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類、エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類、酢酸エチルのようなエステル類等をあげることができる。

【0068】反応温度は、通常0℃乃至100℃、好適には、20〜60℃である。反応時間は、通常30分〜3時間程度である。

【0069】(工程G)本工程は、前記工程Cにより製造されるR^{2a}がアセチル基である化合物(Ic)を、O-メチルヒドロキシルアミン若しくはその塩(例えば、塩酸、硫酸、硝酸のような鉱酸との塩)と反応させることによって、R^{2b}が式-C(=NOCH₃)-CH₃で表わされる基である化合物(Id)を製造する工程である。

【0070】反応は、通常は不活性溶媒中で行なわれ、その様な溶媒としては、例えば、ヘキサン、石油エーテル、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類、クロロホルム、塩化メチレン、o-ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類、エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類、メタノール、エタノールのようなアルコール類、酢酸のような脂肪酸類、水並びにこれらの混合溶媒等をあげることができる。

【0071】反応温度は、好適には、10〜60℃である。反応時間は、通常1時間乃至3日間程度であり、好適には、8時間乃至1日間程度である。

【0072】上記各工程の反応終了後、反応目的物は常法により、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物に水と混和しない有機溶剤を加え水洗後、溶剤を除去することによって得られる。得られた目的化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、再沈殿、ならびにクロマトグラフィー等によって更に精製される。

【0073】本発明の化合物(I)から除草剤及び植物生長調節剤を調製するには、固体担体、液体担体のような担体で希釈し、必要に応じて、界面活性剤のようなその他の製剤用補助剤を加えることにより、粉剤、粗粉剤、粒剤、微粒剤、乳剤、懸濁剤、水和剤、フロアブル剤、水溶剤、液剤等に調製することができる。もちろん、精製の任意の段階で精製を中止し、粗製物を有効成

分とすることもできる。

【0074】担体とは、有効成分の植物への到達性を助け、又は有効成分の貯蔵、輸送或いは取扱を容易にするために除草剤及び植物生長調節剤に混合される合成又は天然の無機又は有機物質を意味する。

【0075】又、除草剤および植物生長調節剤として使用する場合においても、他の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節剤、肥料、土壌改良剤等と混合し、適用範囲を拡大し、省力化を図ることできる。

【0076】処理方法としては、通常製剤化して、雑草の出芽前又は出芽後約1か月以内に土壌処理、茎葉処理又は湛水処理する。土壌処理には、土壌表面処理、土壌混和処理等があり、茎葉処理には、植物体の上方からの処理のほか、作物に付着しないよう雑草に限って処理する局部処理等があり、湛水処理には、粒剤の散布や水面への灌注処理等がある。

【0077】以下、本発明について製剤例と実施例を示し更に詳細に説明するが、本発明はこれらに限られるものではない。

【0078】

【製剤例】

【0079】

【製剤例1】

(水和剤) 1番の化合物10%、エマルゲン810(登録商標)(花王株式会社製界面活性剤)0.5%、デモールN(登録商標)(花王株式会社製界面活性剤)0.5%、クニライト201(クニミネ工業株式会社製珪藻土)20%、ジークライトCA(ジークライト鋁業株式会社製クレイ)69%を均一に混合し粉砕して水和剤とした。

【0080】

【製剤例2】

(乳剤) 4番の化合物30%、乳化剤ソルボールSM100(登録商標)(東邦化学株式会社製界面活性剤)10%及びキシレン60%をよく混合して乳剤とした。

【0081】

【製剤例3】

(粒剤) 3番の化合物5%、ラウリルアルコール硫酸エステルのナトリウム塩2%、リグニンスルホン酸ナトリウム5%、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩2%及びクレー86%を均一に混合し粉砕した。この混合物100重量部に水20重量部を加えて練合し、押出式造粒機を用いて、14~32メッシュの粒状に加工した後、乾燥して粒剤とした。

【0082】

【実施例】

【0083】

【実施例1】

(工程A)

2-クロロメチル-4-ジフルオロメチルニトロベンゼン

3-クロロ-4-ニトロフェノール1.0g(5.8mmol)のジメチルホルムアミド(DMF)溶液に、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド5.7ml(テトラヒドロフラン1.0M溶液)を加え、ついで、30分間、85℃で、クロロジフルオロメタンガスを吹き込んだ。その後、85℃で1.5時間攪拌した。反応終了後、反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を乾燥(MgSO₄)後、濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、0.723g(5.2%)の目的物を得た。

【0084】NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 8.01(d, 1H, J=9.0Hz), 7.33(d, 1H, J=2.6Hz), 7.17(dd, 1H, J=2.6, 9.0Hz), 6.62(t, 1H, J=71.8Hz)。

【0085】

【実施例2】

(工程B)

2-クロロ-4-ジフルオロメチルアニリン

2-クロロ-4-ジフルオロメチルニトロベンゼン0.24g(1.1mmol)のエタノール溶液に、室温で二酸化白金0.5gを加えた後、水素雰囲気下で、1時間攪拌した。反応終了後、反応液をセライトでろ過し、ろ液を濃縮すると、0.12g(55%)の目的物が得られた。

【0086】NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 6.99(d, 1H, J=2.3Hz), 6.63-6.85(m, 2H), 6.30(t, 1H, J=74.3Hz)。

【0087】

【実施例3】

(工程C)

2-(4-アミノ-3-メトキシカルボニルフェノキシ)-4-クロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール

4-アミノ-3-メトキシカルボニルフェノール247mg(1.48mmol)のDMF(5ml)とトルエン(50ml)の混合溶液に、アルゴン気流下、水素化ナトリウム90mg(2.2mmol, 60%純度)を加え、15分間攪拌した。ついで、2,4-ジクロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール300mg(1.48mmol)を加え、60℃で、1.5時間攪拌した。反応終了後、反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を乾燥(MgSO₄)後、濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、0.345g(71%)の目的物を得た。

【0088】NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 7.75(d, 1H, J=2.9Hz), 7.19(dd, 1H, J=2.9, 8.8Hz), 6.82(t, 1H, J=53.9Hz), 6.70(d, 1H, J=8.8Hz) 5.90(br.s, 2H) 3.86(s, 3H)。

【0089】

【実施例4】

(工程D)

2-[4-N, N-ビス(トリフルオロメタンスルホニル)アミノ-3-メトキシカルボニルフェノキシ]-4-クロロ-5-ジフルオロチアゾール及びN-[2-メトキシカルボニル-4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール-2-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド(化合物番号111)

上記実施例3で得た2-(4-アミノ-3-メトキシカルボニルフェノキシ)-4-クロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール0.345g(1.05mmol)の塩化メチレン溶液に、氷冷下、トリエチルアミン0.44mlと無水トリフルオロメタンスルホン酸0.43mlを順次加え、30分攪拌した。反応終了後、反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を乾燥(MgSO₄)後、濃縮し、表記化合物の混合粗生成物を0.60g得た。

【0090】

【実施例5】

(工程E)

N-[2-メトキシカルボニル-4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール-2-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド(化合物番号111)

上記実施例4で得た粗生成物0.60gのテトラヒドロフラン(20ml)と水(10ml)の混合溶液に、3N水酸化ナトリウム1mlを加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を乾燥(MgSO₄)後、濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、0.319g(86%)の目的物を得た。

【0091】

【実施例6】

(工程F)

N-プロピオニル-N-[2-メトキシカルボニル-4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール-2-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド(化合物番号114)

上記実施例4で得たN-[2-メトキシカルボニル-4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール-2-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド0.21g(0.49mmol)の塩化メチレン溶液に、0℃で、トリエチルアミン0.09mlとプロピオニルクロリド0.06mlを順次加え、1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を乾燥(MgSO₄)後、濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、0.18g(70%)の目的物を得た。

【0092】

【実施例7】

(工程G)

N-[2-(1-メトキシイミノエチル)-4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール-2-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド(化合物番号113)

ジオキサン(0.5ml)、メタノール(0.5ml)及び水(0.3ml)の混合溶媒に、上記実施例4の方法に準じて製造されたN-[2-アセチル-4-(4-クロロ-5-ジフルオロメチルチアゾール-2-イルオキシ)フェニル]トリフルオロメタンスルホンアミド24mg(0.052mmol)とO-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩9mg(0.107mmol)を順次加え、室温で24時間攪拌した。反応終了後、反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を乾燥(MgSO₄)後、濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、16mg(63%)の目的物を得た。

【0093】

【発明の効果】本発明化合物(I)は、水田、畑地、果樹園、牧草地、芝生地、森林又は非農耕地の除草剤として使用できる。

【0094】本発明の化合物(I)は、畑作の茎葉処理及び土壌処理において問題となる種々の雑草、例えば、ソバカズラ、スベリヒユ、ハコベ、シロザ、アオゲイトウ、アメリカツノクサネム、エビスグサ、ノハラガラシ、ナズナ、イチビ、アメリカキンゴジカ、フィールドパンジー、ヤエムグラ、セイヨウヒルガオ、ヒメオドリコソウ、ホトケノザ、シロバナチョウセンアサガオ、イヌホオズキ、オオイヌノフグリ、イヌカミツレ、コーンマリーゴールドのような広葉雑草；ヒエ、イヌビエ、エノコログサ、メヒシバ、オヒシバ、スズメノカタビラ、ブラックグラス、スズメノテッポウ、カラスムギ、セイバンモロコシ、シバムギ、ウマノチャヒキ、ギョウギシバのようなイネ科雑草及びツユクサのようなツユクサ科雑草；コゴメガヤツリ、ハマスゲのようなカヤツリグサ科雑草等の種々の雑草に対して、除草活性を示し、かつ、トウモロコシ、コムギ、ダイズのような主要作物に対して問題となるような薬害を示さない。

【0095】又、本発明の化合物(I)は、水田において問題となる種々の雑草、例えば、タイヌビエのようなイネ科雑草；コナギ、アゼナ、キカシグサ、ミゾハコベのような広葉雑草；タマガヤツリ、ホタルイ、マツバ、ミズガヤツリのようなカヤツリグサ科雑草等に対して除草活性を示し、かつ、イネに対しては問題となる薬害を示さない。

【0096】更に、畑地、水田のみならず、果樹園、桑園、非農耕地においても使用することができる。

【0097】尚、本発明化合物は、植物を枯死させることなく、その生長を抑制する作用も有するので、例えば、水稻の短芽化による倒伏防止、芝生の生育抑制による刈込回数の低減等の種々の有用性が期待される。

【0098】次に、生物試験例を挙げて、具体的にその効果を示す。

【0099】

【試験例】

【0100】

【試験例1】

水田雑草発芽前処理

100cm² ポットに水田土壌を充填し、休眠覚醒したタイヌビエの種子を表層1cmに混和した。また、2葉期の水稻の苗を移植して湛水状態とし、温室で生育させた。3日後に、製剤例1に準じて調製した水和剤を用いて所定の薬量を湛水土壌処理し、21日後に、次に示す判定基準に従って調査を行なった。その結果を表2に示す。

【0101】(判定基準)

0: 生育抑制率 0～10%

1: 生育抑制率 11～30%

2: 生育抑制率 31～50%

3: 生育抑制率 51～70%

4: 生育抑制率 71～90%

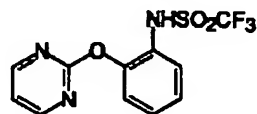
5: 生育抑制率 91～100%

なお、表2及び表3の比較化合物1は、特開平2-14*

*9567号公報に包含される次の化合物である。

【0102】

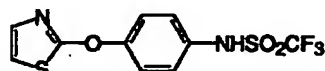
【化5】



【0103】又、表2の比較化合物2は、米国特許3、679、695号公報に記載の次の化合物である。

【0104】

【化6】



【0105】表2及び表3において、EOはタイヌビエを、BLは広葉雑草を、SJはホタルイを、CSはミズガヤツリを、OSは水稻を、ECはイヌビエを、SHはジョンソングラスを、DSはメヒシバを、ISはアサガオを、SAはカラシナを、ARはアオゲイトウをそれぞれ示す。

【0106】

【表2】

化合物番号	薬量(g/a)	EO	BL	SJ	CS	OS
1	5	5	4	5	5	0
3	5	5	5	5	5	0
4	5	4	4	4	4	0
16	5	4	4	5	4	0
17	5	4	5	4	4	0
18	5	5	5	4	2	0
20	5	5	5	3	2	0
23	5	5	2	4	4	0
24	5	5	2	5	5	0
25	5	4	2	5	5	0
27	5	5	2	5	3	0
37	5	5	4	5	4	0
38	5	4	4	4	5	0
39	5	4	5	4	4	0
41	5	5	5	5	4	0
42	5	5	5	5	4	0
43	5	5	5	5	5	0
44	5	5	5	5	3	0
58	5	5	4	5	3	1
59	5	4	3	4	2	0
61	5	5	4	5	5	0
65	5	4	4	5	5	0
78	5	4	4	5	4	0
80	5	5	3	5	5	1
111	5	5	5	4	2	0

45						46
113	5	5	4	5	4	0
114	5	4	4	4	3	0
131	5	5	5	5	5	0
134	5	5	5	4	5	1
139	5	5	5	5	5	1
142	5	4	5	5	5	1
146	5	3	5	5	5	0
147	5	3	5	5	5	0
148	5	3	5	5	5	0
149	5	3	5	5	5	0
152	5	3	5	5	5	0
153	5	3	5	5	5	0
154	5	3	5	5	5	0
155	5	5	5	5	5	1
156	5	3	5	5	5	0
157	5	4	5	5	5	0
158	5	3	5	5	5	0
159	5	4	5	5	5	1
160	5	3	5	5	5	0
161	5	3	5	5	5	0
162	5	3	5	5	5	0
163	5	3	5	5	5	0
164	5	4	5	5	5	1
165	5	4	5	5	5	1
166	5	3	5	5	5	0
167	5	3	5	5	5	0
168	5	3	5	5	5	0
169	5	5	5	4	5	1
173	5	5	5	4	5	1
比較化合物1	5	5	2	0	0	0
比較化合物2	5	5	4	5	5	4

【0107】

【試験例2】

畑雑草発生前土壌処理

面積150cm²のプラスチック製ポットに畑土壌をつめ、イヌビエ、ジョンソングラス、メヒシバ、アサガオ、カラシナ及びアオデイトウの雑草種子を播種した後、1cmの厚さに覆土し、温室内に静置した。

*

*【0108】覆土後直ちに、製剤例1に準じて調製した水和剤を用いて、所定の薬量を土壌表面に処理した。処理後21日目に試験例1に示す判定基準に従って調査を行った。その結果を表3に示す。

【0109】

【表3】

化合物番号	薬量(kg/ha)	EC	SH	DS	IS	SA	AR
1	5	5	5	5	4	5	5
3	5	5	5	5	4	5	5
4	5	4	4	4	4	4	4
15	5	4	4	4	4	4	4
16	5	4	4	5	4	5	5
17	5	5	5	5	4	4	4
18	5	4	4	5	4	4	4
19	5	4	4	5	1	1	1

47							
23	5	5	5	5	3	5	3
37	5	3	5	3	5	5	3
38	5	5	3	3	3	5	4
29	5	4	4	4	4	4	4
30	5	4	4	4	4	4	4
33	5	5	4	5	5	5	5
34	5	5	4	5	4	4	5
35	5	4	4	4	5	4	5
36	5	4	4	4	5	4	5
37	5	4	4	4	4	4	4
38	5	4	4	5	4	4	4
39	5	4	4	4	4	4	4
40	5	4	5	5	5	5	5
41	5	5	5	5	5	5	5
42	5	4	4	4	4	4	5
43	5	4	5	5	4	5	5
46	5	4	4	4	4	4	4
52	5	5	5	5	5	5	5
58	5	5	4	4	4	4	4
61	5	5	4	5	5	5	5
62	5	4	4	4	5	5	5
65	5	5	5	5	4	5	5
69	5	5	5	5	4	5	5
109	5	5	5	5	5	5	4
111	5	5	5	2	3	4	4
131	5	5	5	4	3	3	3
146	5	5	5	4	4	3	3
156	5	5	5	5	3	5	3
164	5	5	5	3	3	5	3
167	5	5	5	3	3	5	3
比較化合物1	5	1	1	3	4	3	3
比較化合物2	5	1	1	2	1	1	1

フロントページの続き

(51)Int. Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C07D 241/44			C07D 241/44	
249/12	502		249/12	502
251/22			251/22	A
253/06			253/06	B
257/04			257/04	G
263/38			263/38	
263/58			263/58	
277/34			277/34	
277/68			277/68	
285/08			285/08	
285/10			285/10	
285/12			285/12	

(72)発明者 小井 清

滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会
社内

(72)発明者 門谷 淳二

滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会
社内